



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 120828

(13) C2

(51) МПК

A61K 31/4745 (2006.01)

C07D 487/04 (2006.01)

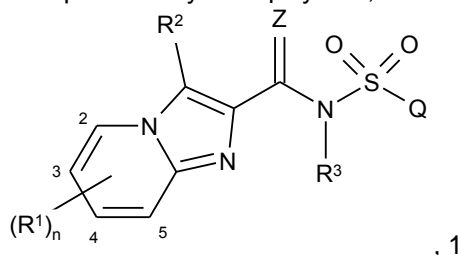
МІНІСТЕРСТВО РОЗВИТКУ
ЕКОНОМІКИ, ТОРГІВЛІ ТА
СІЛЬСЬКОГО ГОСПОДАРСТВА
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2011 11054	(72) Винахідник(и):	Лам Джордж П. (US), Летт Рене Марі (US), Сміт Брентон Тодд (US), Сміт Бенджамін Кенет (US), Дайлі С. Анна (US)
(22) Дата подання заявки:	04.05.2010	(73) Власник(и):	Е. І. ДЮ ПОН ДЕ НЕМУР ЕНД КОМПАНІ, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	25.02.2020	(74) Представник:	Мамуня Олександр Сергійович, реєстр. №357
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/175,206	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2007/019345 A1 (NUNES et al.), 15.02.2007 US 4179277 A (BECK et al.), 18.12.1979 US 2008/0125480 A1 (PEDERSEN et al.), 29.05.2008
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	04.05.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	25.01.2012, Бюл.№ 2		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	25.02.2020, Бюл.№ 4		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2010/033471, 04.05.2010		

(54) НЕМАТОЦИДНІ СУЛЬФОНАМІДИ**(57) Реферат:**

Розкрито сполуки Формули 1, їх N-оксиди та солі:



де

Z являє собою O або S; i

R¹, R², R³, Q і n визначені в розкритті.

Також розкрито композиції, що містять сполуки Формули 1, і способи контролю паразитичної нематоди, що включають контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки або композиції даного винаходу.

UA 120828 C2

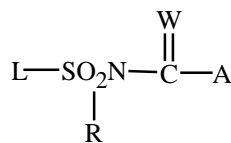
Галузь винаходу

Даний винахід відноситься до певних сульфонамідів, їх N-оксидів, солей і композицій, що придатні для агрономічних і неагрономічних застосувань, і способів їх застосування для боротьби з паразитичними нематодами як в агрономічному, так і в неагрономічному середовищах.

Передумови винаходу

Контроль з паразитичними нематодами в рослин є надзвичайно важливим для досягнення високої ефективності вирощування сільськогосподарської культури. Ушкодження кореня, спричинене нематою, може викликати значне зменшення врожайності і якості сільськогосподарської культури, і таким чином, призводить до підвищеної вартості для споживача. Через розповсюджений розвиток стійкості до антигельмінтних засобів у нематодних паразитів, нематоди продовжують викликати проблеми у домашньої худоби, незважаючи на доступні хімічні терапевтичні засоби. Залишається потреба в нових сполуках, що є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, безпечними для навколишнього середовища або мають різні способи дії.

У публікації заявки на європейський патент №0244166A2 розкривають сполуки Формули і в якості гербіцидів



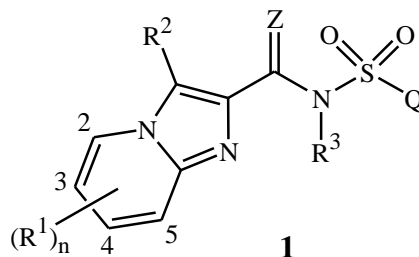
i

де, inter alia, R являє собою H або органічний замісник, W являє собою O або S, L являє собою арильну або гетероарильну частину, і A вибраний з переліку бі-, три- і чотирициклічних гетероциклічних груп.

Сполуки даного винаходу не розкриті в даній публікації.

Короткий опис даного винаходу

Даний винахід відноситься до сполук Формули 1 (включаючи всі стереоізомери), їх N-оксидів, і солей, і композицій, що містять їх, і їхнього застосування для контролю паразитичної нематоди:



1

де

Z являє собою O або S;

кожний R¹ незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹R¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹ або N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹², або C₃-C₇ циклоалкіл, C₄-C₈ циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄ циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}, або C₁-C₆ алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹², або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожний необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ алкіл, C₂-C₄ алкеніл, C₂-C₄ алкініл, C₁-C₄ галогеналкіл, C₂-C₄ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

R² являє собою H, галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹²,

OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹R¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹ або N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃–C₇ циклоалкіл, C₄–C₈ циклоалкілалкіл, C₆–C₁₄ циклоалкілциклоалкіл або C₅–C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно
 5 вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁–C₆ алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожний необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро,
 10 OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ алкіл, C₂–C₄ алкеніл, C₂–C₄ алкініл, C₁–C₄ галогеналкіл, C₂–C₄ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

R³ являє собою H, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкініл, C₂–C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃–C₇ циклоалкіл, C₄–C₈ циклоалкілалкіл або C₅–C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково
 15 заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁–C₆ алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₁–C₆ алкіл, заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце,
 20 кожне необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ алкіл, C₂–C₄ алкеніл, C₂–C₄ алкініл, C₁–C₄ галогеналкіл, C₂–C₄ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}; або феніл, необов'язково заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₄ алкіл, C₂–C₄ алкеніл,
 25 C₂–C₄ алкініл, C₁–C₄ галогеналкіл, C₂–C₄ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкініл, C₂–C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹R¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹, N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹² і R¹⁴;

кожний X незалежно являє собою O або S;

кожний R⁴ незалежно являє собою H, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкініл або C₂–C₆ галогеналкініл; або C₁–C₆ алкіл, C₂–C₆ алкеніл або C₂–C₆ алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} або S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген,
 40 ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₂–C₄ алкеніл, C₂–C₄ алкініл, C₁–C₄ галогеналкіл, C₂–C₄ галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂–C₆ алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

кожний R^{4a} незалежно являє собою H, C₁–C₆ алкіл або C₁–C₆ галогеналкіл;

кожний R⁵ незалежно являє собою H, NR^{5a}R^{6a}, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкініл, C₂–C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃–C₇ циклоалкіл, C₄–C₈ циклоалкілалкіл, C₆–C₁₄ циклоалкілциклоалкіл або C₅–C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками,
 50 незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₂–C₄ алкеніл, C₂–C₄ алкініл, C₁–C₄ галогеналкіл, C₂–C₄ галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂–C₆ алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

кожний R^{5a} незалежно являє собою H або C₁–C₆ алкіл;

кожний R⁶ незалежно являє собою H, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆ галогеналкеніл, C₂–C₆ алкініл або C₂–C₆ галогеналкініл; або C₃–C₇ циклоалкіл, C₄–C₈ циклоалкілалкіл, C₆–C₁₄ циклоалкілциклоалкіл або C₅–C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a};

кожний R^{6a} незалежно являє собою H, C₁–C₆ алкіл, C(O)R¹³ або C(O)OR¹³;

кожний R⁷ незалежно являє собою H, C₁–C₆ алкіл, C₁–C₆ галогеналкіл, C₂–C₆ алкеніл, C₂–C₆

[illegible]

галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл, C_6-C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$,

5 кожний R^{14} незалежно являє собою C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл, C_6-C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$, або C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожний необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$,

10 кожний R^{15} незалежно являє собою C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$, або феніл, необов'язково заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$,

15 кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; і n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4.

25 Даний винахід також спрямовано на такі сполуки Формули 1 (включаючи всі стереоізомери), їх N-оксиди, і солі, і композиції, що містять їх, і їх застосування для боротьби з паразитичною нематодою, як описано вище і далі тут, за умови, якщо n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 у 3-положенні Формули 1, а інший R^1 являє собою Cl у 5-положенні Формули 1, і R^2 і R^3 являють собою H , то Q являє собою відмінне від 2-хлорфенілу, 2-хлор-6-метилфенілу, 2,6-дихлорфенілу, 2-хлор-4-фторфенілу, 2,5-біс(2,2,2-трифторетокси)фенілу, 2,4,6-трихлорфенілу, 2-хлор-5-(трифторметил)фенілу або 3,5-диметил-4-ізоксазолілу.

30 Даний винахід також забезпечує композицію, що містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль, і, щонайменше, один додатковий компонент, вибраний із групи, що включає поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі та рідкі розріджувачі. В одному варіанті здійснення даний винахід також забезпечує композицію для контролю з паразитичною нематодою, що містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль, і, щонайменше, один додатковий компонент, вибраний із групи, що включає поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, зазначена композиція необов'язково додатково містить, щонайменше, одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

40 Даний винахід забезпечує спосіб боротьби з паразитичною нематодою, що включає контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному документі). Даний винахід також відноситься до такого способу, де паразитичну нематоду або її навколишнє середовище приводять у контакт із композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, і, щонайменше, одного додаткового компонента, вибраного з групи, що включає поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, зазначена композиція необов'язково додатково містить біологічно ефективну кількість, щонайменше, однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу.

45 Даний винахід також забезпечує спосіб захисту насіння від паразитичної нематоди, що включає контакт насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному документі). Даний винахід також відноситься до обробленого насіння.

Докладний опис даного винаходу

55 Як використовується в даному документі, вирази "містить", "що містить", "включає", "що включає", "має", "що має", "уміщує", "що вміщує", "що характеризується" або будь-який інший їх варіант призначені покривати невиняткове включення, за винятком будь-якого обмеження, явно позначеного. Наприклад, композиція, суміш, процес або спосіб, що включає перелік елементів, не обов'язково обмежені тільки цими елементами, а можуть включати інші елементи, явно не перераховані або не властиві такий композиції, суміші, процесу або способу.

60 Перехідна фраза "складається з" виключає будь-який точно не визначений елемент, етап

або інгредієнт. У пункті формули винаходу ця фраза буде закривати пункт для включення матеріалів, відмінних від тих, що перераховано, крім домішок, зазвичай зв'язаних з ними. Коли фраза “складається з” з'являється в частині основи пункту формули винаходу, а не відразу після преамбули, вона обмежує тільки елемент, викладений у цій частині; інші елементи не виключаються з пункту формули в цілому.

Перехідна фраза “що складається, головним чином, з” використовується для визначення композиції або способу, що включає матеріали, етапи, ознаки, компоненти або елементи додатково до розкритих буквально за умови, що ці додаткові матеріали, етапи, ознаки, компоненти або елементи дійсно суттєво не впливають на основну і нову характеристику(характеристики) заявленого винаходу. Вираз “що складається, головним чином, з” займає проміжне положення між “що містить” і “складається з”.

Там, де заявники визначили винахід або його частину відкритим виразом, таким як “що містить”, буде легко зрозуміти, що (якщо не зазначене інше) опис варто також розуміти як опис такого винаходу з використанням виразу “що складається, головним чином, з” або “складається з”.

Окрім того, якщо явно не зазначене інше, “або” відноситься до включного або, а не виключного або. Наприклад, умова А або В задовольняється будь-яким одним з наступного: А - вірне (або є присутнім), і В – невірне (або не є присутнім), А – невірне (або не є присутнім), і В - вірне (або є присутнім), і обидва А і В - вірні (або присутні).

Також, одиниця елемента або компонента даного винаходу призначена для того, щоб без обмеження стосуватися числа випадків (тобто подій) елемента або компонента. Отже, одиницю варто читати як таку, що включає один або, щонайменше, один, і форма одиниці елемента або компонента також включає множинну, якщо число очевидно не означає одиницю.

Як застосовують у даному розкритті та формулі винаходу, вираз “нематода” відноситься до живого організму Phylum Nematoda. Як визначено в цілому, “паразит” живе або росте усередині або харчується іншим живим організмом (таким як рослина, тварина або людина), описаним як “хазяїн”. Як згадано в даному розкритті та формулі винаходу, “паразитична нематода” є, зокрема, нематодою, що псує або ушкоджує тканину або викликає інші форми захворювань у рослин, тварин (зокрема, хребетних) або людей.

Паразитарна “інвазія” відноситься до присутності паразитів у кількостях, що становлять загрозу для рослин, людей або тварин. Присутність може бути в навколишньому середовищі, наприклад, у житлі людини або тварини, або майні або спорудах, що оточують, на сільськогосподарській культурі або іншому типі рослини, у підстилці тварини, на шкірі або хутрі тварини і т.д. Якщо згадана інвазія знаходиться у тварині, наприклад, у крові або інших внутрішніх тканинах, вираз інвазія також призначений бути синонімом до виразу “інфекція”, як цей вираз звичайно розуміють у даному рівні техніки, якщо не зазначене інше.

Як визначено в даному розкритті і формулі винаходу, вираз “паразитицидний” і “паразитицидно” відноситься до помітних ефектів на паразитичну нематоду для забезпечення захисту рослини, тварини або людини від нематоди. Паразитицидні ефекти типово стосуються зниження розповсюдженості або активності цільової паразитичної нематоди. Такі ефекти на нематоду включають некроз, загибель, уповільнений ріст, ослаблену рухливість або зменшену здатність утримуватися на або в хазяїні-рослині, тварині або людині, зменшення харчування і інгібування розмноження. Ці ефекти на паразитичних нематод забезпечують боротьбу (включаючи запобігання, зменшення або виключення) з паразитичною інвазією або інфекцією рослини, тварини або людини. Отже “контроль” паразитичної нематоди означає досягнення паразитицидного ефекту на нематоду. Вираз “паразитицидно ефективна кількість” і “біологічно ефективна кількість” у контексті застосування хімічної сполуки для контролю паразитичної нематоди відноситься до кількості сполуки, якої достатньо для контролю паразитичної нематоди.

Вираз “агрономічний” відноситься до виробництва польових сільськогосподарських культур, таких як продовольчі культури і волокнисті культури, та включає вирощування соєвих бобів і інших бобових рослин, зернових (наприклад, пшениця, овес, ячмінь, жито, рис, маїс/кукурудза), листяних овочів (наприклад, латук, капуста й інші капустяні культури), плодові овочі (наприклад, томати, перець, баклажан, хрестоцвітні та гарбуз), картопля, батат, виноград, бавовник, плоди дерева (наприклад, зернятковий, кісточковий і цитрусовий), кущові плодові або ягідні культури (ягоди, вишні) й інші спеціальні сільськогосподарські культури (наприклад, канола, соняшник, оливки).

Вираз “неагрономічний” відноситься до культур, відмінних від польових сільськогосподарських культур, таких як садові культури (наприклад, тепличні, покривні або декоративні рослини, що не ростуть у полі), житлових, сільськогосподарських, торгових і

промислових спорудах, трав'яних шарах (наприклад, господарство з дерниною, вигін, майданчик для гри в гольф, газон, спортивні майданчики і т.д.), деревних продуктах, продуктах, що зберігаються, лісівництві, що відноситься до сільського господарства, і контролі за рослинністю, громадській охороні здоров'я (тобто, людей) і ветеринарії (наприклад, свійських тварин, такі як домашні улюбленці, домашня худоба і домашні птахи, неприручені тварини, такі як дикі).

Неагрономічні застосування включають захист тварини від паразитичної нематоди шляхом введення паразитицидно ефективною (тобто біологічно ефективною) кількості сполуки даного винаходу, типово у формі композиції, складеної для ветеринарного застосування, для тварини, яка має бути захищена.

У вищенаведених переліках вираз "алкіл", використовуваний або окремо, або в складних словах, таких як "галогеналкіл", включає алкіл з прямим або розгалуженим ланцюгом, такий як метил, етил, n-пропіл, i-пропіл або різні ізомери бутилу, пентилу або гексилу. "Алкеніл" включає алкени з прямим або розгалуженим ланцюгом, такі як етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл і різні ізомери бутенілу, пентенілу і гексенілу. "Алкеніл" також включає полієни, такі як 1,2-пропадієніл і 2,4-гексадієніл. "Алкініл" включає алкіни з прямим або розгалуженим ланцюгом, такі як етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл і різні ізомери бутинілу, пентинілу і гексинілу. "Алкініл" може також включати частини, що включають декілька потрібних зв'язків, такі як 2,5-гексадіїніл.

"Алкокси" включає, наприклад, метокси, етокси, n-пропілокси, ізопропілокси і різні ізомери бутокси, пентокси і гексилокси. "Алкокіалкіл" визначає алкокси-заміщення на алкілі. Приклади "алкокіалкілу" 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 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

"Циклоалкіл" включає, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил і циклогексил. Вираз "циклоалкілалкіл" визначає циклоалкільне заміщення на алкілній частині. Приклади "циклоалкілалкілу" включають циклопропілметил, циклопентилетил та інші циклоалкільні частини, зв'язані з алкілними групами з прямим або розгалуженим ланцюгом. "Циклоалкеніл" включає групи, такі як циклопентеніл і циклогексеніл, а також групи з більш ніж одним подвійним зв'язком, такі як 1,3- і 1,4-циклогексадієніл. Вираз "циклоалкілциклоалкіл" визначає циклоалкільне заміщення в іншому циклоалкільному кільці, де кожне циклоалкільне кільце незалежно має від 3 до 7 атомів вуглецю у якості членів кільця. Приклади циклоалкілциклоалкілу включають циклопропілциклопропіл (такий як 1,1'-біциклопропіл-1-іл, 1,1'-біциклопропіл-2-іл), циклогексилциклопентил (такий як 4-циклопентилциклогексил) і циклогексилциклогексил (такий як 1,1'-біциклогексил-1-іл), та різні цис- і транс-циклоалкілциклоалкільні ізомери (такі як (1R,2S)-1,1'-біциклопропіл-2-іл і (1R,2R)-1,1'-біциклопропіл-2-іл).

Вираз "галоген", або окремо, або в складних словах, таких як "галогеналкіл", або коли використовується в описах, таких як "алкіл, заміщений галогеном", включає фтор, хлор, бром або йод. Крім того, коли використовується в складних словах, таких як "галогеналкіл", або коли використовується в описах, таких як "алкіл, заміщений галогеном", зазначений алкіл може бути частково або повністю заміщений атомами галогену, що можуть бути однаковими або різними. Приклади "галогеналкілу" або "алкілу, заміщеного галогеном" включають F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 і CF_3CCl_2 . Вирази "галогеналкокси", "галогеналкеніл", "галогеналкініл" і подібні визначаються аналогічно виразу "галогеналкіл". Приклади "галогеналкокси" включають CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ і $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Приклади "галогеналкенілу" включають $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ і $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$. Приклади "галогеналкінілу" включають $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ і $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$.

Хімічне скорочення C(O), як використовується в даному документі, являє собою карбонільну частину. Наприклад, C(O)CH₃ являє собою ацетильну групу. Хімічні скорочення CO₂ і C(O)O, як використовується в даному документі, являють собою частини складного ефіру. Наприклад, CO₂Me і C(O)OMe являють собою метиловий складний ефір.

"OCN" означає -O-C≡N, і "SCN" означає -S-C≡N.

Загальне число атомів вуглецю в групі замісника позначено індексом "Ci-Cj", де i та j є числами від 1 до 14. C₂ алкокіалкіл визначає CH₃OCH₂; C₃ алкокіалкіл визначає, наприклад, CH₃CH(OCH₃), CH₃OCH₂CH₂ або CH₃CH₂OCH₂; і C₄ алкокіалкіл означає різні ізомери алкільної групи, заміщеної алкоксигрупою, що містить в сумі чотири атоми вуглецю, приклади включають CH₃CH₂CH₂OCH₂ і CH₃CH₂OCH₂CH₂.

Коли сполука заміщена замісником, що має підрядковий індекс, який показує, що число зазначених замісників, може перевищувати 1, зазначені замісники (коли вони перевищують 1) є незалежно вибраними з групи визначених замісників, наприклад, R¹, n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4. Коли група містить замісник, яким може бути водень, наприклад R² або R³, тоді, якщо цей

замісник узятий як водень, варто розуміти, що це еквівалент зазначеній групі, що є незаміщеною. Коли перемінна група, як показано, необов'язково приєднана до положення, наприклад, $(R^V)_r$ в U-29 Додатка 1, де r може бути 0, то водень може бути в положенні, навіть якщо не перераховується у визначенні перемінної групи. Коли одне або більш положень у групі визначені як "такі, що не заміщені" або "незаміщені", те атоми водню приєднуються, щоб зайняти будь-яку вільну валентність.

Якщо не зазначене інше, "кільце" або "кільцева система" як компонент Формули 1 (наприклад, замісник Q) є карбоциклічним або гетероциклічним. Вираз "кільцева система" означає два або декілька злитих кілець. Вираз "гетероциклічне кільце" означає кільце, у якому, щонайменше, один атом, що формує кістяк кільця, не є вуглецем, а є, наприклад, азотом, киснем або сіркою. Типово гетероциклічне кільце містить не більше 4 атомів азоту, не більше 2 атомів кисню і не більше 2 атомів сірки. Якщо не зазначене інше, гетероциклічне кільце може бути насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим кільцем. Вираз "гетероциклічна кільцева система" означає кільцеву систему, у якій, щонайменше, одне кільце кільцевої системи є гетероциклічним кільцем. Якщо не зазначене інше, гетероциклічні кільця і кільцеві системи можуть бути приєднані через будь-який доступний вуглець або азот шляхом заміщення водню на зазначений вуглець або азот.

"Ароматичний" указує, що кожний з атомів кільця, по суті, знаходиться в одній і тій же площині і має p -орбіталь, перпендикулярну до площини кільця, і в якому $(4n + 2)$ π -електрони, де n є додатним цілим числом, зв'язані з кільцем відповідно до правила Хюккеля. Коли повністю ненасичене гетероциклічне кільце відповідає правилу Хюккеля, тоді зазначене кільце також називають "гетероароматичним кільцем". Вираз "гетероароматична кільцева система" означає гетероароматичну кільцеву систему, у якій, щонайменше, одне кільце кільцевої системи є ароматичним.

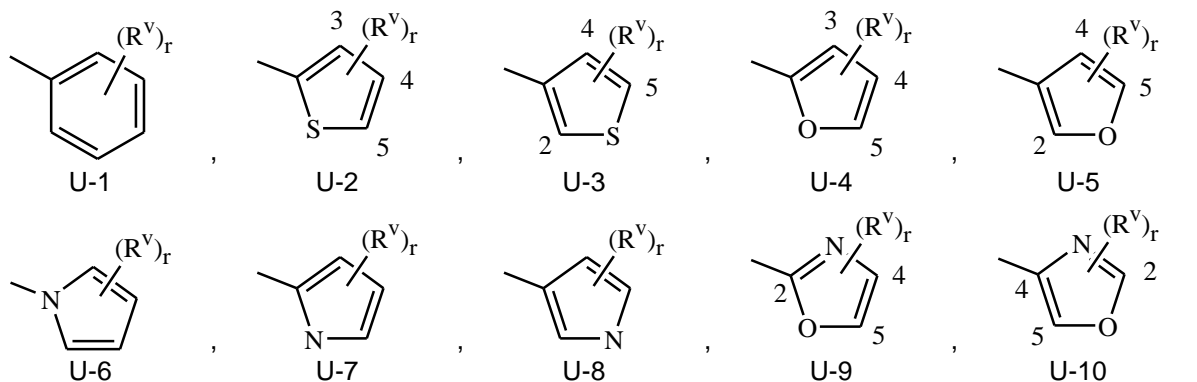
Як використовується в даному документі, будуть застосовуватися наступні позначення, якщо не зазначене інше. Вираз "необов'язково заміщений" використовується взаємозамінно з фразою "заміщений або незаміщений" або з виразом "(не)заміщений". Вираз "необов'язково заміщений 1-4 замісниками" означає, що замісники не присутні (тобто незаміщений), або що присутні 1, 2, 3 або 4 замісники (обмежено числом доступних положень сполуки). Якщо не зазначене інше, необов'язково заміщена група може мати замісник у кожному положенні групи, що заміщається, і кожне заміщення не залежить від іншого.

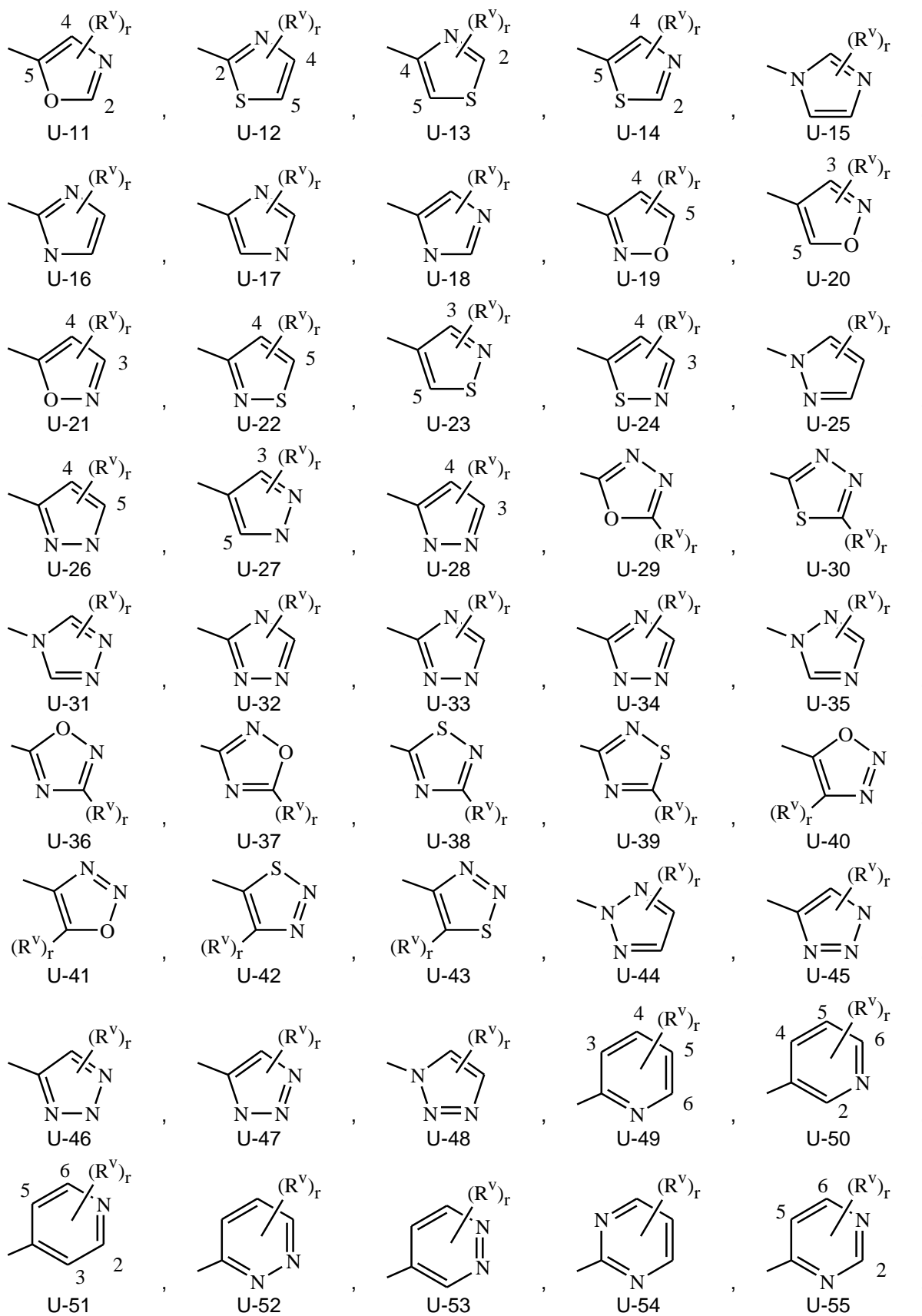
Коли замісником є 5- або 6-членне азотовмісне гетероароматичне кільце, він може бути приєднаний до залишку Формули 1 через будь-який доступний кільцевий атом вуглецю або азоту, якщо не описане інше.

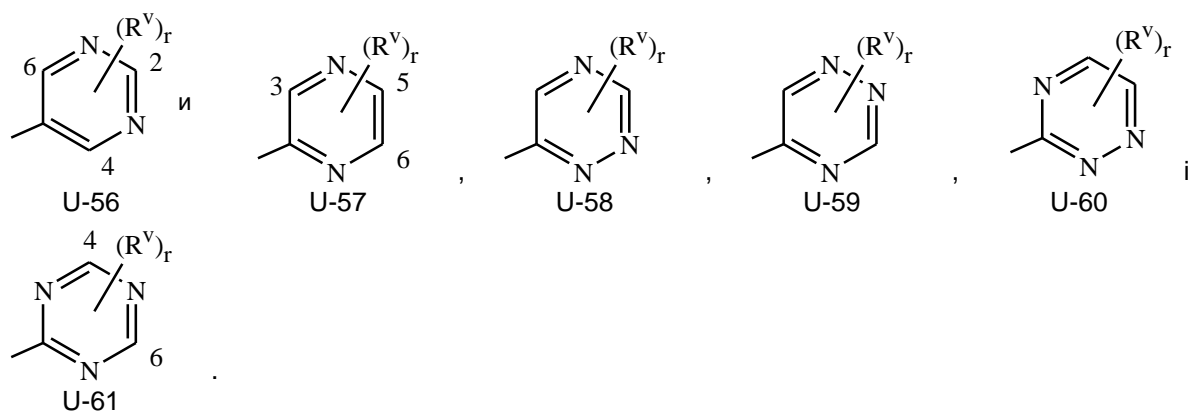
Прикладом фенілу, необов'язково заміщеного одним – п'ятьма замісниками, є кільце, проілюстроване як U-1 у Додатку 1, де R^V є таким, як визначено в Короткому описі даного винаходу для R^1 , R^2 , R^3 або Q, і r є цілим числом від 0 до 5.

Приклади необов'язково заміщеного 5- або 6- членного гетероароматичного кільця включають кільця U-2 - U-61, проілюстровані в Додатку 1, де R^V є будь-яким замісником, як визначено в Короткому описі даного винаходу для R^1 , R^2 , R^3 або Q, і r є цілим числом від 0 до 4, обмеженим кількістю доступних положень у кожній U-групі. Оскільки U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 і U-43 мають тільки одне доступне положення, для цих U груп r є обмеженим цілими числами 0 або 1, і, коли r є 0, це означає, що U група є незаміщеною і водень присутній у положенні, позначеному $(R^V)_r$.

Додаток 1

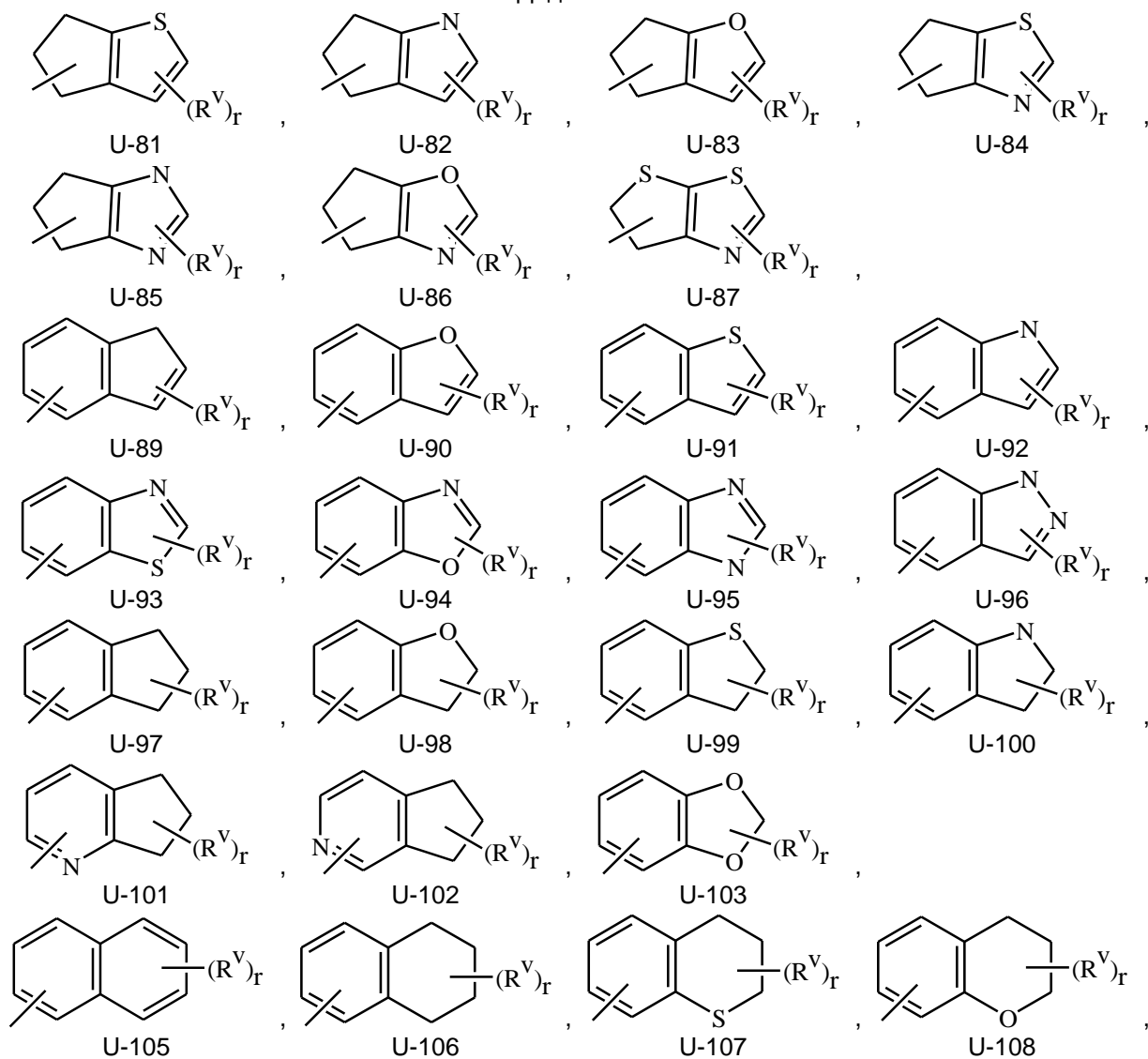


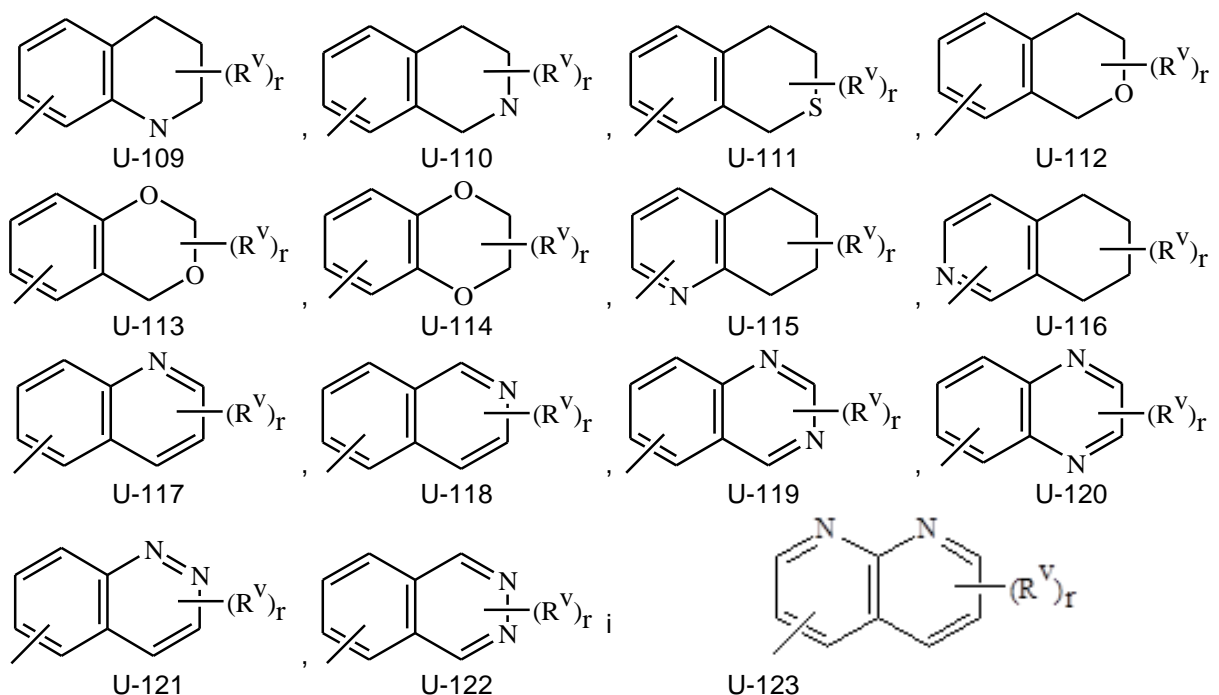




5 Як відзначено вище, Q може бути (серед інших) 8-10-членною гетероароматичною біциклічною кільцевою системою, необов'язково заміщеною замісниками, вибраними з групи замісників, як визначено в Короткому описі винаходу. Приклади необов'язково заміщених 8-, 9- або 10-членних гетероароматичних біциклічних кільцевих систем включають кільця U-81 - U-123, проілюстровані в Додатку 3, де R^V є будь-яким замісником, як визначено в Короткому описі даного винаходу для Q, і г типowo є цілим числом від 0 до 4.

Додаток 3





Хоча R^V групи показані в структурах U-1 - U-123, слід зазначити, що вони не мають бути присутніми, оскільки вони є факультативними замісниками. Атоми азоту, що потребують заміщення для заповнення їх валентності, заміщені H або R^V . Відзначено, що коли точка приєднання між $(R^V)_r$ і U групою показана як плаваюча, $(R^V)_r$ може приєднатися до будь-якого доступного атома вуглецю або атома азоту U групи. Відзначено, що коли точка приєднання в U групі показана як плаваюча, U група може бути приєднана до залишку Формули 1 через будь-який доступний вуглець або азот U групи шляхом заміщення атома водню. Відзначено, що певні U групи можуть бути заміщені тільки менше ніж 4 R^V групами (наприклад, U-2 - U-5, U-7 - U-48 і U-52 - U-61).

Багато різноманітних способів синтезу, відомі в даному рівні техніки, уможливають одержання ароматичних і неароматичних гетероциклічних кілець і кільцевих систем; для широких оглядів дивись збірку з восьми томів Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 і збірку з дванадцяти томів Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Сполуки даного винаходу можуть існувати у вигляді одного або більше стереоізомерів. Різні стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, атропізомери і геометричні ізомери. Фахівець у даній галузі оцінить, що один стереоізомер може бути більш активним і/або може виявляти корисні ефекти, якщо збагачений відносно іншого стереоізомеру(ізомерів) або коли відділений від іншого стереоізомеру(ізомерів). Додатково, фахівцеві відомо, як відокремити, збагатити і/або селективно одержати зазначені стереоізомери. Сполуки даного винаходу можуть бути присутніми у вигляді суміші стереоізомерів, окремих стереоізомерів або як оптично активна форма.

Сполуки, вибрані з Формули 1, (включаючи всі їх стереоізомери, N-оксиди і солі), типово існують у більш ніж одній формі, і Формула 1, таким чином, включає всі кристалічні і некристалічні форми сполук, що представлені Формулою 1. Некристалічні форми включають варіанти здійснення, що є твердими речовинами, такими як воски і смоли, а також варіанти здійснення, що є рідинами, такими як розчини і розплави. Кристалічні форми включають варіанти здійснення, що в основному представляють монокристалічний тип, і варіанти здійснення, що представляють суміш поліморфів (тобто різні кристалічні типи). Вираз "поліморф" відноситься до конкретної кристалічної форми хімічної сполуки, що може кристалізуватися в різні кристалічні форми, ці форми мають різні упакування і/або конформації молекул у кристалічних решітках. Хоча поліморфи можуть мати однакову хімічну композицію, вони також можуть відрізнятися за композицією через присутність або відсутність спільно кристалізованої води або інших молекул, що можуть бути слабо або сильно зв'язані в решітках. Поліморфи можуть відрізнятися за такими хімічними, фізичними та біологічними властивостями як форма кристала, щільність, твердість, колір, хімічна стабільність, точка плавлення,

гігроскопічність, здатність до суспендування, швидкість розчинення та біологічна доступність. Фахівець у даній галузі визнає, що поліморф сполуки, представленої Формулою 1, може виявляти корисні ефекти (наприклад, придатність для одержання застосовних сполук, поліпшена біологічна характеристика) у порівнянні з іншим поліморфом або сумішшю

5 поліморфів такої ж сполуки, представленої Формулою 1. Одержання і виділення визначеного поліморфа сполуки, представленої Формулою 1, може бути досягнуто способами, відомими фахівцям даної галузі техніки включаючи, наприклад, кристалізацію з використанням вибраних розчинників і температур.

Фахівець у даній галузі оцінить, що не всі азотовмісні гетероцикли можуть формувати N-оксиди, оскільки азот потребує доступної неподіленої пари для окислення до оксиду; фахівець у даній галузі впізнає ті азотовмісні гетероцикли, що можуть формувати N-оксиди. Фахівець у даній галузі також визнає, що третинні аміни можуть формувати N-оксиди. Способи синтезу для одержання N-оксидів гетероциклів і третинних амінів дуже добре відомі фахівцям в даній галузі, включаючи окислення гетероциклів і третинних амінів перекислотами, такими як пероцтова і

10 3-хлорпербензойна кислота (MCPBA), пероксид водню, гідропероксиди алкілу, такі як t-бутилгідропероксид, перборат натрію і діоксирани, такі як диметилдіоксидан. Ці способи одержання N-оксидів докладно описані і розглянуті в літературі, дивись, наприклад: T. L. Gilchrist у Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik у Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and

20 A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene у Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Eds., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik у Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; і G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk у Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Фахівець у даній галузі визнає, що, оскільки в навколишньому середовищі і при фізіологічних умовах солі хімічних сполук знаходяться в рівновазі з їх відповідними несольовими формами, солі також мають біологічну корисність несольових форм. Таким чином, широкий ряд солей сполук Формули 1 є застосовними для боротьби з паразитичними нематодами. Солі сполук Формули 1 включають кислотно-адитивні солі з неорганічними або

30 органічними кислотами, такими як бромоводнева, хлороводнева, азотна, фосфорна, сірчана, оцтова, масляна, фумарова, молочна, малеїнова, малінова, щавлева, пропіонова, саліцилова, винна, 4-толуолсульфонова або валеріанова кислоти. Коли сполука Формули 1 містить кислотну частину, таку як карбонова кислота, фенол або сульфоніламід (тобто коли R³ являє собою H), солі також включають такі, утворені з органічними або неорганічними основами, такими як піридин, тріетиламін або аміак, або аміді, гідриди, гідроксиди або карбонати натрію,

35 калію, літію, кальцію, магнію або барію. Відповідно, даний винахід включає сполуки, вибрані з Формули 1, їх N-оксиди і солі.

Варіанти здійснення даного винаходу, як описано в Короткому описі даного винаходу, включають описане нижче. У наступних варіантах здійснення Формула 1 включає її стереоізомери, N-оксиди і солі, і посилання на “сполуку Формули 1” включає визначення замісників, визначених у Короткому описі даного винаходу, якщо вони додатково не визначені у

40 Варіантах здійснення.

Варіант здійснення 1. Сполука Формули 1, де Z являє собою O.

Варіант здійснення 2. Сполука Формули 1, де Z являє собою S.

45 Варіант здійснення 3. Сполука Формули 1 або Варіант здійснення 1 або 2, де кожний R¹ незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, OR⁴, C₁–C₆ алкіл або C₁–C₆ галогеналкіл.

Варіант здійснення 3a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 3, де кожний R¹ незалежно являє собою галоген, C₁–C₆ галогеналкіл або C₁–C₆ галогеналкокси (тобто OR⁴ і R⁴ являє собою C₁–C₆ галогеналкіл).

50 Варіант здійснення 3b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 3a, де n дорівнює 2, і один R¹ знаходиться в 3-положенні Формули 1, а другий R¹ знаходиться в 5-положенні Формули 1.

Варіант здійснення 3c. Сполука відповідно до варіанта здійснення 3a або 3b, де кожний R¹ незалежно являє собою галоген або C₁–C₂ галогеналкіл.

55 Варіант здійснення 3d. Сполука відповідно до варіанта здійснення 3c, де кожний R¹ незалежно являє собою F, Cl, Br або CF₃.

Варіант здійснення 3e. Сполука відповідно до варіанта здійснення 3c, де n дорівнює 2, і кожний R¹ незалежно являє собою F, Cl, Br або CF₃.

Варіант здійснення 3f. Сполука Формули 1, де n дорівнює 1, і R¹ являє собою CF₃ і

60 знаходиться в 3-положенні Формули 1.

Варіант здійснення 3g. Сполука Формули 1, де n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні Формули 1, а другий R^1 являє собою Cl і знаходиться в 5-положенні Формули 1.

Варіант здійснення 3h. Сполука Формули 1, де n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні Формули 1, а другий R^1 являє собою Br і знаходиться в 5-положенні Формули 1.

Варіант здійснення 3i. Сполука Формули 1, де n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні Формули 1, а другий R^1 являє собою F і знаходиться в 5-положенні Формули 1.

Варіант здійснення 4. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1–3i, де Q являє собою феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне необов'язково заміщене 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 4a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4, де Q являє собою феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне необов'язково заміщене 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^{4a} , C_1-C_3 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл і $C(O)R^{7b}$;

кожний R^{4a} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл; і

кожний R^{7b} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл.

Варіант здійснення 4b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4, де Q являє собою феніл, піридиніл, піразоліл, оксазоліл, тiazоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, фураніл або тієніл, кожний необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 4c. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4b, де Q являє собою феніл, піридиніл, піразоліл, оксазоліл, тiazоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, фураніл або тієніл, кожний необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^{4a} , C_1-C_3 алкіл і C_1-C_3 галогеналкіл; і

кожний R^{4a} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл.

Варіант здійснення 4d. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4b, де Q являє собою феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 4e. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4d, де Q являє собою феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^{4a} , C_1-C_3 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл і $C(O)R^{7b}$;

кожний R^{4a} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл; і

кожний R^{7b} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл.

Варіант здійснення 4f. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4b, де Q являє собою піридиніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 4g. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4f, де Q являє собою піридиніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^{4a} , C_1-C_3 алкіл і C_1-C_3 галогеналкіл; і

кожний R^{4a} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл.

Варіант здійснення 4h. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4b, де Q являє собою піразоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 4i. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4h, де Q являє собою піразоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^{4a} , C_1-C_3 алкіл і C_1-C_3 галогеналкіл; і

кожний R^{4a} незалежно являє собою C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл.

Варіант здійснення 4х. Сполука відповідно до варіанта здійснення 4b, де Q являє собою фураніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, $C(X)R^7$ і $C(O)OR^8$.

Варіант здійснення 5. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-4х, де R^2 являє собою H, галоген або C_1-C_6 алкіл.

Варіант здійснення 5a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 5, де R^2 являє собою H, F, Cl, Br або C_1-C_2 алкіл.

Варіант здійснення 5b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 5a, де R^2 являє собою H, Cl, Br або CH_3 .

Варіант здійснення 5с. Сполука відповідно до варіанта здійснення 5a, де R^2 являє собою H.

Варіант здійснення 6. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-5с, де R^3 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ або $S(O)_mR^9$; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 OR^4 .

Варіант здійснення 6a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 6, де R^3 являє собою H або C_1-C_6 алкіл.

Варіант здійснення 6b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 6a, де R^3 являє собою H.

Варіант здійснення 7. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-6b, де R^4 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 8. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-7, де R^5 являє собою H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл, C_6-C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$.

Варіант здійснення 9. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-8, де R^6 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл або C_4-C_8 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл і OR^{4a} ;

Варіант здійснення 10. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-9, де R^7 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл, C_6-C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$.

Варіант здійснення 11. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-10, де R^8 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл, C_6-C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 12. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-11, де R^9 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 13. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 1-12, де R^{10} являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл.

Варіант здійснення 14. Сполука Формули 1 або відповідно до будь-якого з варіантів

здійснення 1–13, де R^{14} являє собою C_3 – C_7 циклоалкіл, C_4 – C_8 циклоалкілалкіл або C_5 – C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1–4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 – C_4 алкіл, C_1 – C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 – C_6 алкіл, заміщений 1–4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_6 алкіл, C_1 – C_6 галогеналкіл, C_2 – C_6 алкеніл, C_2 – C_6 галогеналкеніл, C_2 – C_6 алкініл, C_2 – C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіанти здійснення даного винаходу, включаючи варіанти здійснення 1–14 вище, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, можна поєднувати будь-яким способом, і описи змінних у варіантах здійснення належать не тільки сполукам Формули 1, але і також початковим сполукам і проміжним хімічним сполукам, застосовним для одержання сполук Формули 1. До того ж варіанти здійснення даного винаходу, включаючи варіанти здійснення 1–14 вище, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, і будь-яка їх комбінація, належать композиціям і способам даного винаходу.

Проілюстровано комбінації варіантів здійснення 1–14:

Варіант здійснення А. Сполука Формули 1, де

Z являє собою O ; і

Q являє собою феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне необов'язково заміщене 1–3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 алкіл, C_2 – C_4 алкеніл, C_2 – C_4 алкініл, C_1 – C_4 галогеналкіл, C_2 – C_4 галогеналкеніл, C_2 – C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення В. Сполука відповідно до варіанта здійснення А, де

Q являє собою феніл, піридиніл, піразоліл, оксазоліл, тiazоліл, ізоксазоліл, ізотiazоліл, фураніл або тієніл, кожний необов'язково заміщений 1–3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 – C_4 алкіл, C_2 – C_4 алкеніл, C_2 – C_4 алкініл, C_1 – C_4 галогеналкіл, C_2 – C_4 галогеналкеніл, C_2 – C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення С. Сполука відповідно до варіанта здійснення В, де

кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, OR^4 , C_1 – C_6 алкіл або C_1 – C_6 галогеналкіл;

R^2 являє собою H , галоген або C_1 – C_6 алкіл;

R^3 являє собою H , C_1 – C_6 алкіл, C_1 – C_6 галогеналкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ або $S(O)_mR^9$; або C_1 – C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 OR^4 ; і

n дорівнює 1 або 2.

Специфічні варіанти здійснення включають сполуки Формули 1, вибрані з групи, що складається з:

8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(4-ціано-2,5-диметилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

N-[(5-ацетил-2-хлорфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(3-метил-2-тієніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(4-метил-2-тієніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(3-хлор-1-метил-1Н-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(5-метокси-2-нітрофеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(2-хлор-5-етилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(1-етил-3-метил-1Н-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-бром-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

N-[(2-бром-5-метилфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

8-хлор-N-[(2-хлор-5-метилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду,

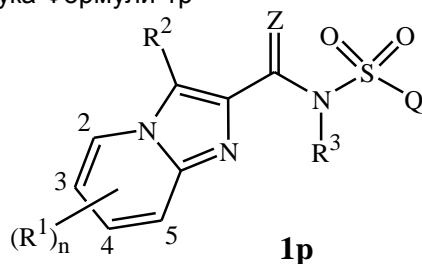
8-хлор-N-[(3-хлор-1-етил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

5 N-[(5-ацетил-2-метилфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

Додаткові варіанти здійснення даного винаходу, як описано в короткому описі даного винаходу, включають описані нижче. У наступних варіантах здійснення, Формула 1p включає її стереоізомери, N-оксиди і солі, і посилання на "сполуку Формули 1p" включають визначення замісників, визначених у короткому описі даного винаходу, якщо додатково не визначені у

10 варіантах здійснення.

Варіант здійснення 15. Сполука Формули 1p



де

Z являє собою O або S;

15 кожний R¹ незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} або N(R¹⁰)C(O)R^{7a}; або C₃-C₇ циклоалкіл, C₄-C₈ циклоалкілалкіл або C₅-C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆ алкіл, заміщений галогеном, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкілом, C₁-C₆ галогеналкілом, C₂-C₆ алкенілом, C₂-C₆ галогеналкенілом, C₂-C₆ алкінілом, C₂-C₆ галогеналкінілом, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожний необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ алкіл, C₂-C₄ алкеніл, C₂-C₄ алкініл, C₁-C₄ галогеналкіл, C₂-C₄ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

R² являє собою H, галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇ циклоалкіл, C₄-C₈ циклоалкілалкіл або C₅-C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆ алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²;

R³ являє собою H, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇ циклоалкіл, C₄-C₈ циклоалкілалкіл або C₅-C₇ циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆ алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, необов'язково заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ алкіл, C₂-C₄ алкеніл, C₂-C₄ алкініл, C₁-C₄ галогеналкіл, C₂-C₄ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне необов'язково заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ галогеналкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₂-C₆ галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a}, N(R¹⁰)C(O)R^{7a} і R¹⁴;

кожний X незалежно являє собою O або S;

[illegible]

або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;

кожний R^{10a} незалежно являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл;

кожний R^{11} незалежно являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$, або C_1-C_6 алкіл, заміщений галогеном, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, або фенол, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

кожний R^{11a} незалежно являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл;

кожний R^{12} незалежно являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл;

кожний R^{13} незалежно являє собою H або C_1-C_4 алкіл;

кожний R^{14} незалежно являє собою C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$, або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ і $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; або фенол, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожний необов'язково заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;

кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; і

n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4.

Варіант здійснення 16. Сполука Формули 1р, де Z являє собою O.

Варіант здійснення 17. Сполука Формули 1р, де Z являє собою S.

Варіант здійснення 18. Сполука Формули 1р або Варіант здійснення 1 або 2, де кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , C_1-C_6 алкіл або C_1-C_6 галогеналкіл.

Варіант здійснення 18a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 18, де кожний R^1 незалежно являє собою галоген, C_1-C_6 галогеналкіл або C_1-C_6 галогеналкокси (тобто OR^{4a} і R^{4a} являє собою C_1-C_6 галогеналкіл).

Варіант здійснення 18b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 18a, де n дорівнює 2, і один R^1 знаходиться в 3-положенні, і другий R^1 знаходиться в 5-положенні.

Варіант здійснення 18c. Сполука відповідно до варіанта здійснення 18a або 18b, де кожний R^1 незалежно являє собою галоген або C_1-C_2 галогеналкіл.

Варіант здійснення 18d. Сполука відповідно до варіанта здійснення 18c, де кожний R^1 незалежно являє собою Cl, Br або CF_3 .

Варіант здійснення 18e. Сполука відповідно до варіанта здійснення 18c, де n дорівнює 2, і кожний R^1 незалежно являє собою Cl, Br або CF_3 .

Варіант здійснення 18f. Сполука Формули 1р, де n дорівнює 1, і R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні.

Варіант здійснення 18g. Сполука Формули 1р, де n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні, і другий R^1 являє собою Cl і знаходиться в 5-положенні.

Варіант здійснення 18h. Сполука Формули 1р, де n дорівнює 2, і один R^1 являє собою CF_3 і знаходиться в 3-положенні, і другий R^1 являє собою Br і знаходиться в 5-положенні.

Варіант здійснення 19. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–18h, де Q являє собою фенол або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне необов'язково заміщене 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19a. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19, де Q являє собою фенол, піридиніл, піразоліл, оксазоліл, тiazоліл, ізоксазоліл, ізотiazоліл або тієніл, кожний необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4

галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає 5 галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19с. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19а, де Q являє собою піридиніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$; $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19d. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою піразоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$; $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19е. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19а, де Q являє собою оксазоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^{5R^6} , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11R^{12}}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11R^{12}}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19f. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою тiazоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19g. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою ізоксазоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$; $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19h. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою ізотіазоліл, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що 35 включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$; $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19i. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19a, де Q являє собою тієніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає 40 галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення 19j. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19b, де Q являє собою феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає 45 галоген, ціано, OR⁴, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, C(X)R⁷ і C(O)OR⁸.

Варіант здійснення 19k. Сполука відповідно до варіанта здійснення 19с, де Q являє собою піридиніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, OR⁴, C₁–C₄ алкіл, C₁–C₄ галогеналкіл, C(X)R⁷ і C(O)OR⁸.

Варіант здійснення 20. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–19к, де R² являє собою H, галоген або C₁–C₆ алкіл.

Варіант здійснення 20а. Сполука відповідно до варіанта здійснення 20, де R^2 являє собою H, F, Cl, Br або C_1-C_2 алкіл.

Варіант здійснення 20b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 20a, де R² являє собою H, Cl, Br або CH₃.

55 Варіант здійснення 21. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–20b, де R^3 являє собою H , C_1 – C_6 алкіл, C_1 – C_6 галогеналкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ або $S(O)_mR^9$; або C_1 – C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 OR^4 .

Варіант здійснення 21а. Сполука відповідно до варіанта здійснення 21, де R^3 являє собою H або C_1-C_6 алкіл.

Варіант здійснення 21b. Сполука відповідно до варіанта здійснення 21a, де R^3 являє

собою Н.

Варіант здійснення 22. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–21b, де R^4 являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 23. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–22, де R^5 являє собою Н, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний необов'язково заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$.

Варіант здійснення 24. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–23, де R^6 являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл або C_4-C_8 циклоалкілалкіл, кожний факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл і OR^{4a} .

Варіант здійснення 25. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–24, де R^7 являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$.

Варіант здійснення 26. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–25, де R^8 являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 27. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–26, де R^9 являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл або C_2-C_6 галогеналкініл; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіант здійснення 28. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–27, де R^{10} являє собою Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл або C_2-C_6 алкініл.

Варіант здійснення 29. Сполука Формули 1р або відповідно до будь-якого з варіантів здійснення 15–28, де R^{14} являє собою C_3-C_7 циклоалкіл, C_4-C_8 циклоалкілалкіл або C_5-C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$.

Варіанти здійснення даного винаходу, включаючи вищевикладені варіанти здійснення 15–29, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, можна поєднати будь-яким способом, і описи змінних у варіантах здійснення мають відношення не тільки до сполук Формули 1р, але також до початкових сполук і проміжних хімічних сполук, придатних для одержання сполук Формули 1р. До того ж варіанти здійснення даного винаходу, включаючи вищевикладені варіанти здійснення 15–29, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, та будь-яка їх комбінація, мають відношення до композицій і способів даного винаходу.

Комбінації варіантів здійснення 15–29 проілюстровано за допомогою:

Варіант здійснення А1. Сполука Формули 1р, де

Z являє собою О; і

Q являє собою феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення B1. Сполука відповідно до варіанта здійснення A1, де

Q являє собою феніл, піридиніл, піразоліл, оксазоліл, тіазоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл або тієніл, кожний факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 алкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 алкініл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 галогеналкеніл, C_2-C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Варіант здійснення C1. Сполука відповідно до варіанта здійснення B1, де

кожний R^1 незалежно являє собою H, галоген, ціано, нітро, OR^4 , C_1-C_6 алкіл або C_1-C_6 галогеналкіл;

R^2 являє собою H, галоген або C_1-C_6 алкіл;

R^3 являє собою H, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ або $S(O)_mR^9$; або C_1-C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 OR^4 ; і

n дорівнює 1 або 2.

Слід зазначити, що сполуки даного винаходу характеризуються сприятливими метаболічними властивостями та/або властивістю здатності залишатися у ґрунті певний час і виявляють активність для контролю спектру агрономічних і неагрономічних паразитичних нематод.

Зокрема слід зазначити, що з огляду на спектр контролю паразитичних нематод та економічну важливість, захист агрономічних сільськогосподарських культур від псування або пошкодження, спричинених паразитичними нематодами, за допомогою контролю паразитичних нематод є варіантами здійснення даного винаходу. Сполуки даного винаходу внаслідок їх сприятливих властивостей пересування по рослині або системності розповсюдження в рослинах також захищають листяну або інші частини рослини, що не знаходяться в безпосередньому контакті зі сполукою Формули 1 або композицією, що містить сполуку.

Також примітними як варіанти здійснення даного винаходу є композиції, що містять сполуку за будь-яким з попередніх варіантів здійснення, а також будь-якими іншими варіантами здійснення, описаними в даному документі, та будь-які їх комбінації, та, щонайменше, один додатковий компонент, вибраний із групи, що складається з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача та рідкого розріджувача, причому зазначені композиції факультативно додатково містять, щонайменше, одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

Крім того, примітними як варіанти здійснення даного винаходу є композиції для контролю паразитичної нематоди, що містять сполуку за будь-яким з попередніх варіантів здійснення, а також будь-якими іншими варіантами здійснення, описаними в даному документі, та будь-які їх комбінації, і, щонайменше, один додатковий компонент, вибраний із групи, що складається з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача та рідкого розріджувача, причому зазначені композиції факультативно додатково містять, щонайменше, одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб. Варіанти здійснення даного винаходу, крім того, включають способи контролю паразитичної нематоди, що включають контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки за будь-яким з попередніх варіантів здійснення (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному документі).

Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію, що містить сполуку за будь-яким з попередніх варіантів здійснення, у формі рідкого складу для просочення ґрунту. Варіанти здійснення даного винаходу, крім того, включають способи контролю паразитичної нематоди, що включають контакт ґрунту з рідкою композицією, такий як просочення ґрунту, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх варіантів здійснення.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію у вигляді розчину для розпилення для контролю паразитичної нематоди, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх варіантів здійснення та диспергатор. Варіанти здійснення даного винаходу, крім того, включають композицію-приманку для контролю паразитичної нематоди, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх варіантів здійснення, один або більше харчових матеріалів, факультативно аттрактант і факультативно зволожувач.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи захисту насіння від паразитичної нематоди, що включають контакт насіння з біологічно ефективною кількістю

сполуки за будь-яким з попередніх варіантів здійснення.

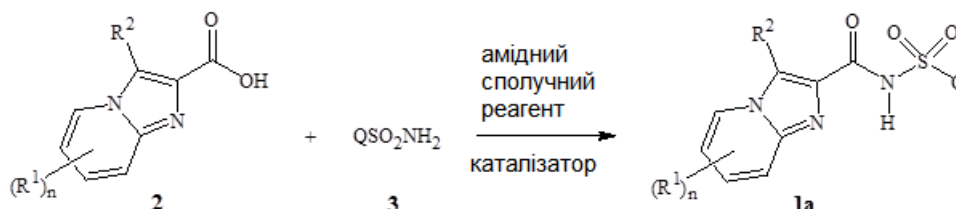
Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи контролю паразитичної нематоди, що включають контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному документі) за умови, що способи не є способами медичного лікування організму людини або тварини за допомогою терапії.

Даний винахід також стосується таких способів, де паразитичну нематоду або її навколишнє середовище вводять у контакт із композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі та, щонайменше, один додатковий компонент, вибраний з групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, причому зазначена композиція факультативно додатково містить біологічно ефективну кількість, щонайменше, однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу за умови, що способи не є способами медичного лікування організму людини або тварини за допомогою терапії.

Один або більше з наступних способів і варіацій, як описано в Схемах 1–8, можна використовувати для одержання сполук Формули 1. Визначення X, Q, R¹, R² і R³ у сполуках Формул 1a–1c і 2–10 нижче є такими, як визначено вище в Короткому описі даного винаходу, якщо не зазначене інше. Формули 1a–1c являють собою різні підкласи Формули 1, і всі замісники для Формул 1a–1c є такими, як визначено вище для Формули 1, якщо не зазначене інше. Кімнатна температура становить від приблизно 20 до 25°C.

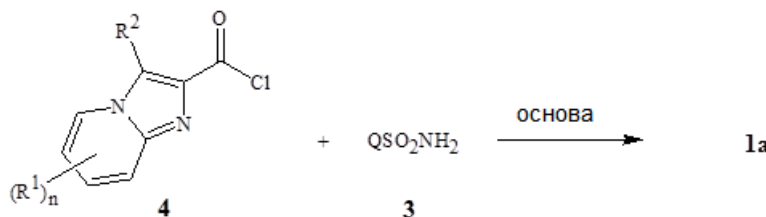
Сполуки Формули 1a (тобто Формула 1, де Z являє собою кисень, і R³ являє собою H) можна одержати реакцією карбонових кислот Формули 2 з арильними або гетероарильними сульфонамідами Формули 3, як показано на Схемі 1. Типово, амідний сполучний реагент і каталізатор, такий як N,N-диметиламінопіридин (DMAP), застосовують у способі Схеми 1. Амідні сполучні реагенти включають 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)-карбодіімід гідрохлорид (EDC), N,N'-біциклогексилкарбодіімід (DCC) і 1,1'-карбонілдіімідазол (CDI). Реакцію можна проводити при температурі в діапазоні від кімнатної температури до температури флегми розчинника. Типові розчинники включають спирти, ефіри, складні ефіри, аміди та галогеновані вуглеводні. Етап D Прикладу Синтезу 1 описує особливо застосовний набір умов з використанням EDC/DMAP у суміші розчинника 1:1 t-бутанолу та дихлорметану.

Схема 1



Сполуки Формули 1a можна також одержати реакцією хлоридів карбонової кислоти Формули 4 з арильними або гетероарильними сульфонамідами Формули 3, як показано в Схемі 2. Реакція типово включає застосування основи, такої як триетиламін або піридин, і факультативно каталізатора, такого як DMAP, у присутності розчинника. Реакцію можна проводити при температурах у діапазоні від кімнатної температури до температури флегми розчинника. Типові розчинники включають ефіри, складні ефіри та галогеновані вуглеводні.

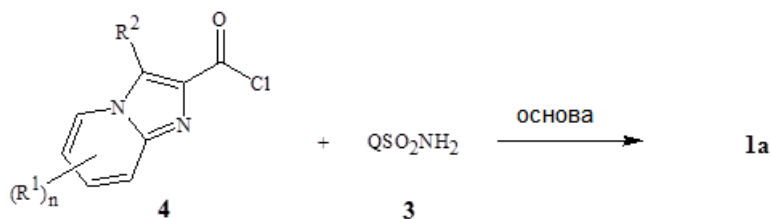
Схема 2



Сполуки Формули 1b, де R³ являє собою факультативно заміщений алкіл, алкеніл, алкініл або циклоалкіл, можна одержати реакцією сполук Формули 1a з відповідно заміщеними галідами алкілу, алкенілу, алкінілу або циклоалкілу та основою, як показано в Схемі 3. Типові

умови реакції включають карбонат калію у якості основи і DMF у якості розчинника.

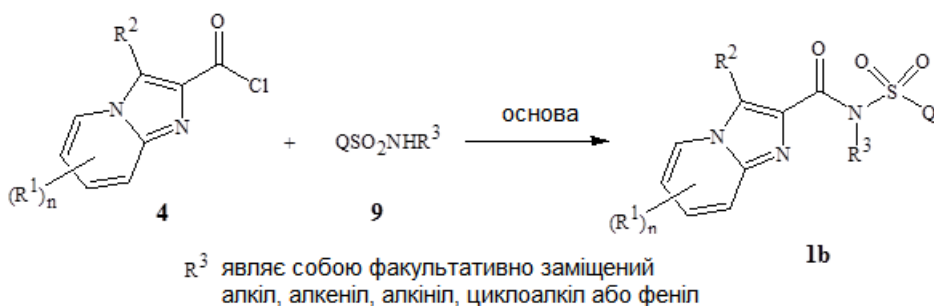
Схема 3



Сполуки Формули 1b, де R^3 являє собою $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_2R^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, можна одержати реакцією сполук Формули 1a з ацильними або сульфонільними галідами (наприклад, $ClC(X)R^7$, $ClC(O)OR^8$, $ClC(O)NR^{11}R^{12}$, $ClS(O)_2R^9$ або $ClS(O)_2NR^{11}R^{12}$) за допомогою ацилювання або сульфонування, добре відомих в даному рівні техніки.

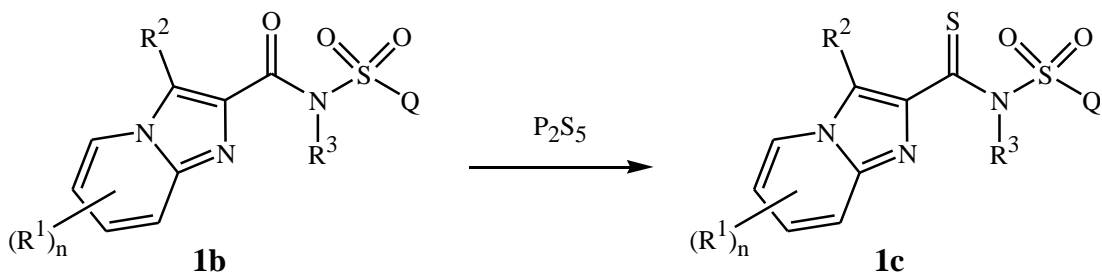
Сполуки Формули 1b, де R^3 являє собою факультативно заміщений алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл або феніл, можна одержати реакцією хлорангідридів Формули 4 із сульфонамідами Формули 9, як показано в Схемі 4. Альтернативно, сполуки Формули 1b, де R^3 являє собою факультативно заміщений алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл або феніл, можна одержати реакцією карбонових кислот Формули 2 із сульфонамідами Формули 9 способом за Схемою 1.

Схема 4



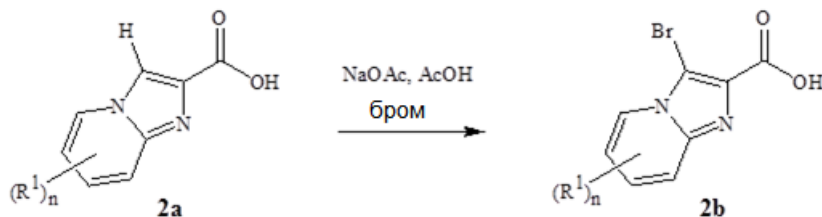
Тіоаміди Формули 1c (тобто Формула 1, де X являє собою сірку) можна одержати реакцією сполук Формули 1b (тобто Формула 1, де X являє собою O) з реагентами, що тіонують, такими як пентасульфід фосфору або реагент Лоуссона, як зображено на Схемі 5.

Схема 5



Сполуки Формули 2b (тобто Формула 2, де R^2 являє собою бром) можна одержати реакцією сполук Формули 2a (тобто Формула 2, де R^2 являє собою H) з бромом в оцтовій кислоті в присутності ацетату натрію, як описано в Heterocycles 2002, 57(1), 21–38.

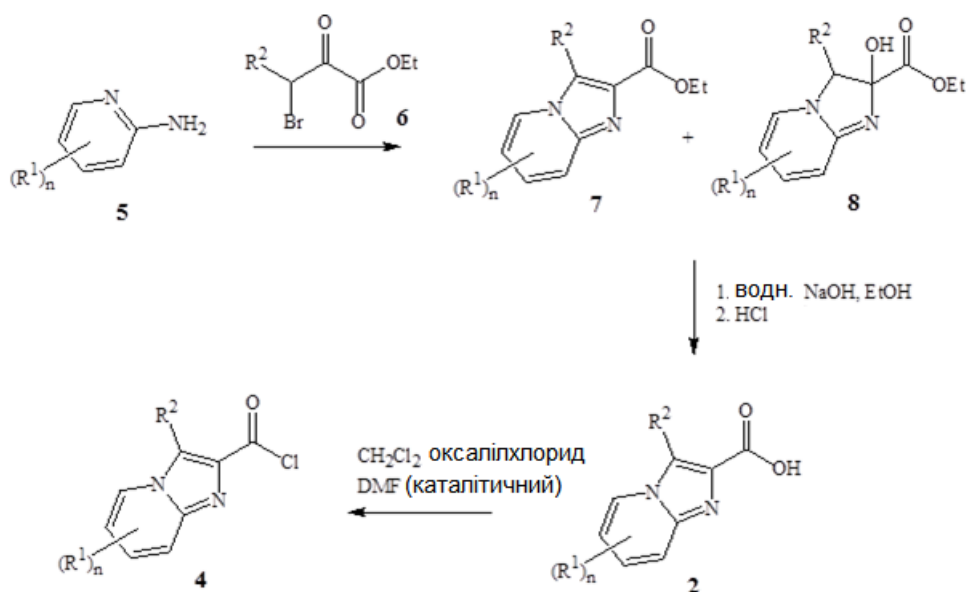
Схема 6



Сполуки Формули 2, де R^2 являє собою ціано, можна одержати реакцією сполук Формули 2b з CuCN способами, відомими в даному рівні техніки. Сполуки Формули 2, де R^2 являє собою нітро, можна одержати реакцією сполук Формули 2a з азотною кислотою/сірчаною кислотою, як описано в *Bioorganic Med. Chem. Lett.* 2005, 15(11), 2790–2794. Сполуки Формули 2, де R^2 являє собою OR^4 , NR^5R^6 або SR^9 , можна одержати зі сполук Формули 2, де R^2 являє собою F, за допомогою стандартних реакцій заміщення, добре відомих в даному рівні техніки. Сполуки Формули 2, де R^2 являє собою F, можна одержати, як описано в *Russian Chem. Bull.* 2005, 54(2), 470–471.

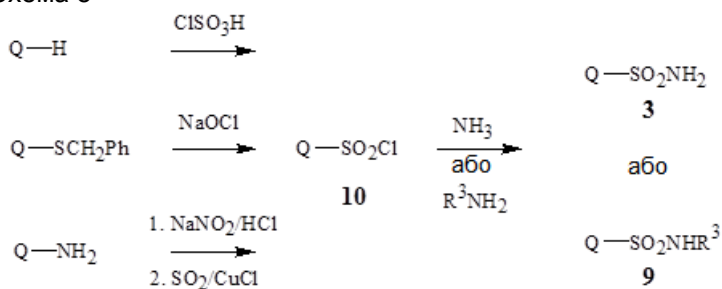
Карбонові кислоти Формули 2 і хлорангідриди Формули 4 можна одержати реакціями, показаними на Схемі 7. Реакція придатно заміщеного 2-амінопіридину Формули 5 з 2-бромпіруватом Формули 6, де R^2 являє собою H, факультативно заміщений алкіл, алкеніл, алкініл, C(O)R^7 , C(O)OR^8 , або $\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, або факультативно заміщений феніл, нафталеніл, або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, при температурах у діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника дає складний ефір карбонової кислоти Формули 7 разом з варіюючими кількостями спирту Формули 8. Нагрівання реакційної суміші до кипіння в розчиннику, такому як 1,2-диметоксетан, дає в результаті повне перетворення спирту 8 у складний ефір 7. Обробка суміші складних ефірів 7 і 8 водною гідроксидною основою, такою як гідроксид натрію, у розчиннику, що змішується з водою, таким як етанол, дає в результаті гідроліз складного ефіру з утворенням карбонової кислоти Формули 2 після підкислення сильною кислотою, такою як хлороводнева кислота. Даний спосіб описаний докладно на Етапі С Прикладу синтезу 1. Карбонову кислоту Формули 2 можна перетворити на хлорангідрид Формули 4 добре відомими традиційними способами, такими як обробка тіонилхлоридом або оксалілхлоридом з каталітичною кількістю N,N-диметилформаміду (DMF) у помірно полярних, апротонних розчинниках, включаючи дихлорметан, дихлоретан, толуол і етилацетат. Проміжні хімічні сполуки Формули 6 можна одержати різноманітними добре відомими способами синтезу, включаючи бромовання факультативно заміщених піруватів або лактатів (альфа-гідрокси складні ефіри). Типові умови реакції включають пряме бромовання бромом (див., наприклад, *JACS* 1944, 66, 1656–1659) або CuBr_2 в етилацетаті/хлороформі (див., наприклад, *JOC* 2002, 67(4), 1102–1108), або реакцію лактату з N-бромсукцинімідом у CCl_4 (див., наприклад, *JACS* 1954, 76, 5796–5797).

Схема 7



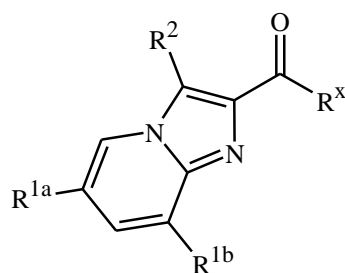
- 5 Сульфонаміди Формул 3 і 9 відомі в хімічній літературі або доступні комерційно. Як показано в Схемі 8, сульфонаміди Формули 3 легко одержують з відповідних сульфонілхлоридів Формули 10 за допомогою реакції з аміаком, тоді як сульфонаміди Формули 9 легко одержують з відповідних сульфонілхлоридів Формули 10 за допомогою реакції з R^3NH_2 . Проміжні хімічні сполуки сульфонілхлориду доступні комерційно або можуть бути отримані за допомогою багатьох різноманітних способів, відомих у літературі. Три з найбільш загальноновживаний способів одержання сульфонілхлориду показані на Схемі 8, що включає (а) пряме хлорсульфонування ароматичних і гетероароматичних систем хлорсульфоновою кислотою, (b) окислювання сульфідів (наприклад, гіпохлоритом натрію) у присутності хлороводневої кислоти та (c) діазотування і хлорсульфонування ароматичних і гетероароматичних амінів. Ці три способи слід розуміти тільки як ілюстративні; є велике різномайття інших способів синтезу для одержання сульфонілхлоридів і сульфонамідів.

Схема 8



Приклади проміжних хімічних сполук, застосовних при одержанні сполук за даним винаходом, показані в Таблицях I-1 - I-12. У Таблицях використовуються наступні аббревіатури: Me означає метил, Et означає етил, i-Pr означає ізопропіл, n-Pr означає нормальний пропіл, OMe означає метокси, і SMe означає тіометокси.

Таблица I-1

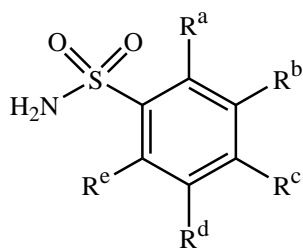


R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x
H	H	H	Cl	H	H	Cl	Cl
H	H	H	OH	H	H	Cl	OH
H	H	H	OCH ₃	H	H	Cl	OCH ₃
H	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	H	H	Cl	CF ₃	H	Cl	Cl
CF ₃	H	H	OH	CF ₃	H	Cl	OH
CF ₃	H	H	OCH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₃
CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl
CF ₃	Cl	H	OH	CF ₃	Cl	Cl	OH
CF ₃	Cl	H	OCH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₃
CF ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Br	H	Cl	CF ₃	Br	Cl	Cl
CF ₃	Br	H	OH	CF ₃	Br	Cl	OH
CF ₃	Br	H	OCH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₃
CF ₃	Br	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	H	Cl	Cl	H	Cl	Cl
Cl	H	H	OH	Cl	H	Cl	OH
Cl	H	H	OCH ₃	Cl	H	Cl	OCH ₃
Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Cl	Cl	H	OH	Cl	Cl	Cl	OH
Cl	Cl	H	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
Cl	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
Br	H	H	Cl	Br	H	Cl	Cl
Br	H	H	OH	Br	H	Cl	OH
Br	H	H	OCH ₃	Br	H	Cl	OCH ₃
Br	H	H	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Br	Br	H	Cl	Br	Br	Cl	Cl
Br	Br	H	OH	Br	Br	Cl	OH
Br	Br	H	OCH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₃
Br	Br	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	H	Br	Cl	H	H	CH ₃	Cl
H	H	Br	OH	H	H	CH ₃	OH
H	H	Br	OCH ₃	H	H	CH ₃	OCH ₃
H	H	Br	OCH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	H	Br	Cl	CF ₃	H	CH ₃	Cl
CF ₃	H	Br	OH	CF ₃	H	CH ₃	OH
CF ₃	H	Br	OCH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Cl	Br	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	Cl
CF ₃	Cl	Br	OH	CF ₃	Cl	CH ₃	OH
CF ₃	Cl	Br	OCH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
CF ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
CF ₃	Br	Br	Cl	CF ₃	Br	CH ₃	Cl
CF ₃	Br	Br	OH	CF ₃	Br	CH ₃	OH
CF ₃	Br	Br	OCH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₃

Таблиця І-1 (продовження)

R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ^x
CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Br	Cl	Cl	H	CH ₃	Cl
Cl	H	Br	OH	Cl	H	CH ₃	OH
Cl	H	Br	OCH ₃	Cl	H	CH ₃	OCH ₃
Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	Br	Cl	Cl	Cl	CH ₃	Cl
Cl	Cl	Br	OH	Cl	Cl	CH ₃	OH
Cl	Cl	Br	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
Cl	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Br	H	Br	Cl	Br	H	CH ₃	Cl
Br	H	Br	OH	Br	H	CH ₃	OH
Br	H	Br	OCH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₃
Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Br	Br	Br	Cl	Br	Br	CH ₃	Cl
Br	Br	Br	OH	Br	Br	CH ₃	OH
Br	Br	Br	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
Br	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃

Таблиця І-2

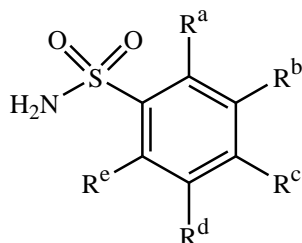


R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Me	H	H	H
H	F	H	H	H	Me	F	H	H	H
H	Cl	H	H	H	Me	Cl	H	H	H
H	Br	H	H	H	Me	Br	H	H	H
H	CF ₃	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H
H	ціано	H	H	H	Me	ціано	H	H	H
H	OMe	H	H	H	Me	OMe	H	H	H
H	SMe	H	H	H	Me	SMe	H	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	Me	H	H	H	Cl	Me	H	H	H
F	F	H	H	H	Cl	F	H	H	H
F	Cl	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H
F	Br	H	H	H	Cl	Br	H	H	H
F	CF ₃	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H
F	ціано	H	H	H	Cl	ціано	H	H	H
F	OMe	H	H	H	Cl	OMe	H	H	H
F	SMe	H	H	H	Cl	SMe	H	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	Me	H	H	H	CF ₃	Me	H	H	H
Br	F	H	H	H	CF ₃	F	H	H	H
Br	Cl	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H
Br	Br	H	H	H	CF ₃	Br	H	H	H
Br	CF ₃	H	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H
Br	ціано	H	H	H	CF ₃	ціано	H	H	H
Br	OMe	H	H	H	CF ₃	OMe	H	H	H
Br	SMe	H	H	H	CF ₃	SMe	H	H	H

Таблиця І-2 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
ціано	H	H	H	H	ціано	Br	H	H	H
ціано	Me	H	H	H	ціано	CF ₃	H	H	H
ціано	F	H	H	H	ціано	ціано	H	H	H
ціано	Cl	H	H	H	ціано	OMe	H	H	H
					ціано	SMe	H	H	H

Таблиця І-2а

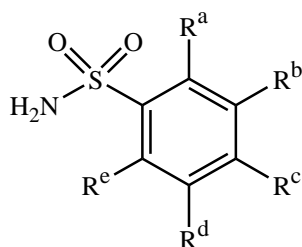


R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	Me	H	Me	H	H	Me	H
H	H	H	Et	H	Me	H	H	Et	H
H	H	H	i-Pr	H	Me	H	H	i-Pr	H
H	H	H	F	H	Me	H	H	F	H
H	H	H	Cl	H	Me	H	H	Cl	H
H	H	H	Br	H	Me	H	H	Br	H
H	H	H	CF ₃	H	Me	H	H	CF ₃	H
H	H	H	ціано	H	Me	H	H	ціано	H
H	H	H	OMe	H	Me	H	H	OMe	H
H	H	H	OEt	H	Me	H	H	OEt	H
H	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
H	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	Me	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
H	H	H	SMe	H	Me	H	H	SMe	H
H	H	H	C(O)CH ₃	H	Me	H	H	C(O)CH ₃	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	Me	H	Cl	H	H	Me	H
F	H	H	Et	H	Cl	H	H	Et	H
F	H	H	i-Pr	H	Cl	H	H	i-Pr	H
F	H	H	F	H	Cl	H	H	F	H
F	H	H	Cl	H	Cl	H	H	Cl	H
F	H	H	Br	H	Cl	H	H	Br	H
F	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	CF ₃	H
F	H	H	ціано	H	Cl	H	H	ціано	H
F	H	H	OMe	H	Cl	H	H	OMe	H
F	H	H	OEt	H	Cl	H	H	OEt	H
F	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
F	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
F	H	H	SMe	H	Cl	H	H	SMe	H
F	H	H	C(O)CH ₃	H	Cl	H	H	C(O)CH ₃	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	Me	H
Br	H	H	Et	H	CF ₃	H	H	Et	H
Br	H	H	i-Pr	H	CF ₃	H	H	i-Pr	H
Br	H	H	F	H	CF ₃	H	H	F	H
Br	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H	Cl	H
Br	H	H	Br	H	CF ₃	H	H	Br	H
Br	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H
Br	H	H	ціано	H	CF ₃	H	H	ціано	H

Таблица I-2a (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
Br	H	H	OMe	H	CF ₃	H	H	OMe	H
Br	H	H	OEt	H	CF ₃	H	H	OEt	H
Br	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
Br	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
Br	H	H	SMe	H	CF ₃	H	H	SMe	H
Br	H	H	C(O)CH ₃	H	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	H
ціано	H	H	H	H	ціано	H	H	CF ₃	H
ціано	H	H	Me	H	ціано	H	H	ціано	H
ціано	H	H	Et	H	ціано	H	H	OMe	H
ціано	H	H	i-Pr	H	ціано	H	H	OEt	H
ціано	H	H	F	H	ціано	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H
ціано	H	H	Cl	H	ціано	H	H	OCH ₂ CF ₃	H
ціано	H	H	Br	H	ціано	H	H	SMe	H
					ціано	H	H	C(O)CH ₃	H

Таблица I-2b

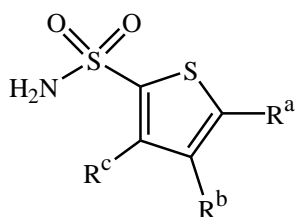


R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
H	H	F	H	H	Cl	H	F	H	H
H	H	F	Cl	H	Cl	H	F	Cl	H
H	H	F	Br	H	Cl	H	F	Br	H
H	H	F	Me	H	Cl	H	F	Me	H
H	H	F	Et	H	Cl	H	F	Et	H
H	H	F	OMe	H	Cl	H	F	OMe	H
H	H	F	ацетил	H	Cl	H	F	ацетил	H
H	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
H	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H
H	H	Cl	Br	H	Cl	H	Cl	Br	H
H	H	Cl	Me	H	Cl	H	Cl	Me	H
H	H	Cl	Et	H	Cl	H	Cl	Et	H
H	H	Cl	OMe	H	Cl	H	Cl	OMe	H
H	H	Cl	ацетил	H	Cl	H	Cl	ацетил	H
H	H	Br	H	H	Cl	H	Br	H	H
H	H	Br	Cl	H	Cl	H	Br	Cl	H
H	H	Br	Br	H	Cl	H	Br	Br	H
H	H	Br	Me	H	Cl	H	Br	Me	H
H	H	Br	Et	H	Cl	H	Br	Et	H
H	H	Br	OMe	H	Cl	H	Br	OMe	H
H	H	Br	ацетил	H	Cl	H	Br	ацетил	H
H	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
H	H	Me	Cl	H	Cl	H	Me	Cl	H
H	H	Me	Br	H	Cl	H	Me	Br	H
H	H	Me	Me	H	Cl	H	Me	Me	H
H	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	Et	H
H	H	Me	OMe	H	Cl	H	Me	OMe	H
H	H	Me	ацетил	H	Cl	H	Me	ацетил	H
Br	H	F	H	H	Me	H	F	H	H
Br	H	F	Cl	H	Me	H	F	Cl	H

Таблица I-2b (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
Br	H	F	Br	H	Me	H	F	Br	H
Br	H	F	Me	H	Me	H	F	Me	H
Br	H	F	Et	H	Me	H	F	Et	H
Br	H	F	OMe	H	Me	H	F	OMe	H
Br	H	F	ацетил	H	Me	H	F	ацетил	H
Br	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
Br	H	Cl	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H
Br	H	Cl	Br	H	Me	H	Cl	Br	H
Br	H	Cl	Me	H	Me	H	Cl	Me	H
Br	H	Cl	Et	H	Me	H	Cl	Et	H
Br	H	Cl	OMe	H	Me	H	Cl	OMe	H
Br	H	Cl	ацетил	H	Me	H	Cl	ацетил	H
Br	H	Br	H	H	Me	H	Br	H	H
Br	H	Br	Cl	H	Me	H	Br	Cl	H
Br	H	Br	Br	H	Me	H	Br	Br	H
Br	H	Br	Me	H	Me	H	Br	Me	H
Br	H	Br	Et	H	Me	H	Br	Et	H
Br	H	Br	OMe	H	Me	H	Br	OMe	H
Br	H	Br	ацетил	H	Me	H	Br	ацетил	H
Br	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
Br	H	Me	Cl	H	Me	H	Me	Cl	H
Br	H	Me	Br	H	Me	H	Me	Br	H
Br	H	Me	Me	H	Me	H	Me	Me	H
Br	H	Me	Et	H	Me	H	Me	Et	H
Br	H	Me	OMe	H	Me	H	Me	OMe	H
Br	H	Me	ацетил	H	Me	H	Me	ацетил	H

Таблица I-3

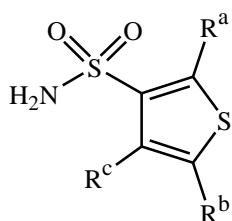


R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br
H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			

Таблиця І-3 (продовження)

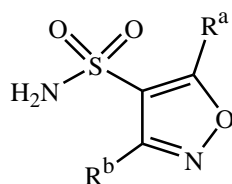
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
Br	H	Br	Et	H	Br
Br	Me	H	Et	Me	H
Br	Me	Me	Et	Me	Me
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl
Br	Me	Br	Et	Me	Br
Br	Et	H	Et	Et	H
Br	Et	Me	Et	Et	Me
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl
Br	Et	Br	Et	Et	Br
Br	Cl	H	Et	Cl	H
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br

Таблиця І-4



R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			
Et	H	Cl	Br	H	Cl			
Et	Me	H	Br	Me	H			
Et	Me	Me	Br	Me	Me			
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl			
Et	Et	H	Br	Et	H			
Et	Et	Me	Br	Et	Me			
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl			

Таблица I-5

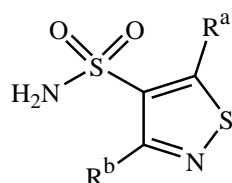


R ^a		R ^b	
H		H	
H		Me	
H		Cl	

R ^a		R ^b	
Me		H	
Me		Me	
Me		Cl	

R ^a		R ^b	
Cl		H	
Cl		Me	
Cl		Cl	

Таблица I-6

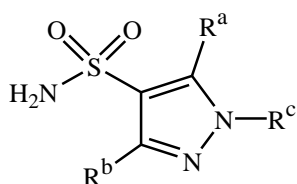


R ^a		R ^b	
H		H	
H		Me	
H		Cl	

R ^a		R ^b	
Me		H	
Me		Me	
Me		Cl	

R ^a		R ^b	
Cl		H	
Cl		Me	
Cl		Cl	

Таблица I-7



R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me
H	H	Et
H	H	i-Pr
H	H	n-Pr
Br	H	Me
Br	H	Et
Br	H	i-Pr
Br	H	n-Pr
Cl	Me	Me
Cl	Me	Et
Cl	Me	i-Pr
Cl	Me	n-Pr
Me	Cl	Me
Me	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr
Me	Cl	n-Pr
H	Br	Me
H	Br	Et
H	Br	i-Pr
H	Br	n-Pr
Br	Br	Me
Br	Br	Et

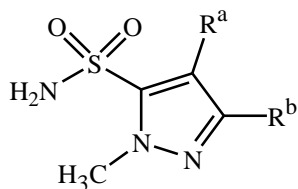
R ^a	R ^b	R ^c
Me	H	Me
Me	H	Et
Me	H	i-Pr
Me	H	n-Pr
H	Me	Me
H	Me	Et
H	Me	i-Pr
H	Me	n-Pr
Br	Me	Me
Br	Me	Et
Br	Me	i-Pr
Br	Me	n-Pr
Cl	Cl	Me
Cl	Cl	Et
Cl	Cl	i-Pr
Cl	Cl	n-Pr
Me	Br	Me
Me	Br	Et
Me	Br	i-Pr
Me	Br	n-Pr

R ^a	R ^b	R ^c
Cl	H	Me
Cl	H	Et
Cl	H	i-Pr
Cl	H	n-Pr
Me	Me	Me
Me	Me	Et
Me	Me	i-Pr
Me	Me	n-Pr
H	Cl	Me
H	Cl	Et
H	Cl	i-Pr
H	Cl	n-Pr
Br	Cl	Me
Br	Cl	Et
Br	Cl	i-Pr
Br	Cl	n-Pr
Cl	Br	Me
Cl	Br	Et
Cl	Br	i-Pr
Cl	Br	n-Pr

Таблиця І-7 (продовження)

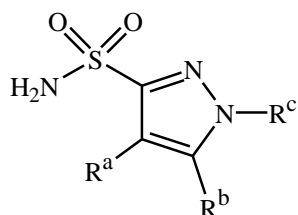
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	н-Pr						

Таблиця І-8



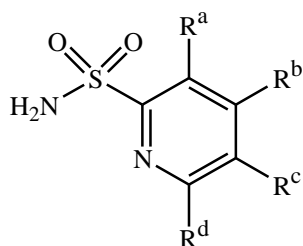
R ^a	R ^b	R ^a	R ^b	R ^a	R ^b	R ^a	R ^b
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	i-Pr	Me	i-Pr	Cl	i-Pr	Br	i-Pr
H	н-Pr	Me	н-Pr	Cl	н-Pr	Br	н-Pr

Таблиця І-9



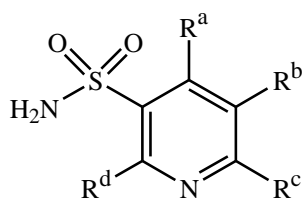
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	i-Pr	Me	H	i-Pr	Cl	H	i-Pr
H	H	н-Pr	Me	H	н-Pr	Cl	H	н-Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	i-Pr	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr
Br	H	н-Pr	H	Me	н-Pr	Me	Me	н-Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	i-Pr	Br	Me	i-Pr	H	Cl	i-Pr
Cl	Me	н-Pr	Br	Me	н-Pr	H	Cl	н-Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr	Cl	Cl	i-Pr	Br	Cl	i-Pr
Me	Cl	н-Pr	Cl	Cl	н-Pr	Br	Cl	н-Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	i-Pr	Me	Br	i-Pr	Cl	Br	i-Pr
H	Br	н-Pr	Me	Br	н-Pr	Cl	Br	н-Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	н-Pr						

Таблица I-10



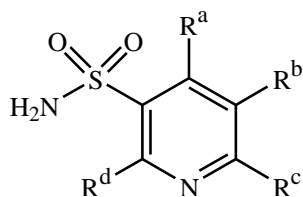
R ^a	R ^b	R ^c	R ^d		R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
Me	H	H	H		Cl	H	H	H
Me	H	H	Me		Cl	H	H	Me
Me	H	H	OMe		Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H		Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me		Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	OMe		Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H		Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me		Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	OMe		Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H		Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me		Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	OMe		Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H		Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me		Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	OMe		Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H		Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me		Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	OMe		Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H		Br	OMe	Me	H
Br	H	H	Me		Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	OMe		Br	OMe	Me	OMe
Br	OMe	H	H		Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me		Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	OMe		Br	Me	H	OMe
Br	H	Me	H		Br	Me	Me	H
Br	H	Me	Me		Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	OMe		Br	Me	Me	OMe

Таблица I-11



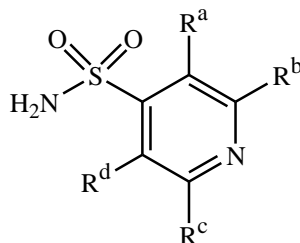
R ^a	R ^b	R ^c	R ^d		R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	H	H	H		Me	H	H	H
H	H	H	Me		Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃		Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl		Me	H	H	Cl
H	H	H	Br		Me	H	H	Br
H	H	Me	H		Me	H	Me	H
H	H	Me	Me		Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃		Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl		Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br		Me	H	Me	Br

Таблиця І-11 (продовження)



R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H
H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H
H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me
H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

Таблиця І-12



R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

Зрозуміло, що деякі реагенти та умови реакції, описані вище для одержання сполук Формули 1, можуть не бути сумісними з певними функціональними групами, що є присутніми у проміжних хімічних сполуках. У цих випадках включення послідовностей захисту/зняття захисту або взаємоперетворень функціональних груп у синтез допоможе в одержанні бажаних продуктів. Застосування і вибір захисних груп будуть очевидними для фахівця в хімічному синтезі (дивись, наприклад, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Фахівець у даній галузі визнає, що в деяких випадках після введення даного реагенту, як це показано в будь-якій окремій схемі, може бути необхідним виконання додаткових стандартних етапів синтезу, не описаних в деталях, для завершення синтезу сполук Формули 1. Фахівець у даній галузі також визнає, що може бути необхідним виконання комбінації етапів, показаних у вищенаведених схемах, в іншому порядку, ніж передбачається конкретною послідовністю, представленою для одержання сполук Формули 1.

Фахівець у даній галузі також визнає, що сполуки Формули 1 і проміжні хімічні сполуки, описані в даному документі, можуть бути піддані різноманітним електрофільним, нуклеофільним, радикальним, металорганічним, окисним і відновним реакціям для приєднання замісників або модифікації існуючих замісників.

Без додаткового уточнення, вважається, що фахівець у даній галузі з використанням попереднього опису, може застосувати даний винахід у його найповній мірі. Наступні Приклади синтезу, отже, повинні розглядатися тільки як ілюстративні, а не такі, що обмежують розкриття будь-яким чином у будь-якій формі. Етапи в наступних Прикладах синтезу ілюструють процедуру для кожного етапу в загальній синтетичній трансформації, і вихідний матеріал для кожного етапу не обов'язково має бути отриманий за допомогою конкретного циклу одержання, процедура якого описана в інших Прикладах або Етапах. Спектри ¹H ЯМР представлено в частинах на мільйон слабого поля від тетраметилсилану; "s" означає синглет, "d" означає дуплет, "dd" означає дуплет дуплетів, "br s" означає широкий синглет. Кімнатна температура складає від приблизно 20°C до 25°C.

Приклад синтезу 1

Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

Етап А: Одержання 2-хлор-5-метоксибензолсульфонілхлориду

У 3-шийкову колбу, обладнану сухим льодовим конденсатором, додали оцтову кислоту (80 мл) і хлорид міді (0,8 г). Суміш охолоджували до 0°C, конденсували діоксид сірки (5 мл) у реакційну колбу, і потім реакційну суміш перемішували 30 хвилин. В окрему 200 мл круглодонну колбу додали концентровану хлороводневу кислоту (32 мл), оцтову кислоту (8 мл) і 2-хлор-5-метиланіліну гідрохлорид (3,2 г, 16 ммоль). Цю суміш охолодили до 0°C, і додали по краплях нітрит натрію (1,25 г, 18,1 ммоль) у воді (8 мл), при цьому підтримуючи температуру нижче 10°C. Реакційну суміш перемішували 30 хвилин і потім додавали по краплях до розчину діоксиду сірки. Отриману в результаті реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 години. Додали по краплях воду, та жовтувато-коричневу тверду речовину осадили. Тверду речовину виділили фільтрацією та промили водою з одержанням 2,5 г названої сполуки. ¹H

ЯМР (CDCl_3) δ 7,64 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 3,89 (s, 3H).

Етап В: Одержання 2-хлор-5-метоксибензолсульфонаміду

До розчину 2-хлор-5-метоксибензолсульфонілхлориду (2,5 г, 10,4 ммоль) (тобто продукт Етапу А) у тетрагідрофурані (30 мл) додавали по краплях 30% гідроксид амонію (3,0 мл, 25,7 ммоль). Реакційну суміш перемішували 15 хвилин, протягом яких утворилася суспензія. До цієї суміші додали воду (10 мл), і тетрагідрофуран випарили під зниженим тиском, щоб залишити водну суспензію жовтувато-коричневої твердої речовини. Тверду речовину виділили фільтрацією та промили водою з одержанням 2,2 г названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,63 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 5,13 (br s, 2H), 3,85 (s, 3H).

Етап С: Одержання 8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбонової кислоти

До розчину 2-аміно-3-хлор-5-(трифторметил)піридину (24,7 г, 126 ммоль) у 1,2-диметоксетані (260 мл) при 0°C додавали по краплях етилбромпіруват (17,43 мл, 138 ммоль). Реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури та перемішували три дні для утворення суспензії. Реакційну суміш потім екстрагували дихлорметаном (2 x 200 мл) і промили водою (2 x 200 мл). Об'єднані дихлорметанові екстракти висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском з одержанням твердого залишку. Об'єднані водні змиви насичували карбонатом натрію, екстрагували етилацетатом (2 x 200 мл) і висушили над сульфатом магнію. Об'єднані етилацетатні екстракти та залишок, отриманий в результаті концентрування дихлорметаном, об'єднали та суміш концентрували під зниженим тиском з одержанням твердої речовини.

Тверду речовину розчинили в етанолі (800 мл) і додали по краплях водний 50% гідроксид натрію (40 г, 500 ммоль), об'єднаний з додатковою водою (150 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі для утворення суспензії. Реакційну суміш підкислили до pH 2 концентрованою хлороводною кислотою, та потім охолодили, та перемішували кілька годин для осадження твердої речовини. Твердий продукт виділили фільтрацією із застосуванням лійки з фільтром зі скловидної фрити, промили водою та висушили на повітрі під потоком повітря протягом ночі з одержанням 13 г названої сполуки у вигляді твердої речовини. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,51 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,55 (s, 1H).

Етап D: Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

До карбонової кислоти з Етапу С (243 мг, 0,92 ммоль) додали розчин 4-(диметиламіно)піридину (340 мг, 2,76 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіімідгідрохлориду (232 мг, 2,3 ммоль) у t-бутанолі (5 мл) і дихлорметані (5 мл). Реакційну суміш перемішували протягом 15 хвилин, додали 2-хлор-5-метоксибензолсульфонамід (190 мг, 0,86 ммоль) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім додали дихлорметан (200 мл), суміш екстрагували 1 Н хлороводною кислотою (3 x 100 мл), і відділену органічну фазу висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском з одержанням твердої речовини. Тверду речовину промили діетиловим ефіром з одержанням 240 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді білої твердої речовини, т.пл. $211-212^\circ\text{C}$. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 10,10 (br s, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,54 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,09 (dd, 1H), 3,91 (s, 3H).

Приклад синтезу 2

Одержання 8-хлор-N-[(4-ціано-2,5-диметилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

Етап А: Одержання 4-бром-2,5-диметилбензолсульфонаміду

До хлорсульфоновної кислоти (4,2 мл, 63 ммоль), охолодженої до 10°C , додавали по краплях 2-бром-р-ксилон (5,0 г, 27 ммоль) протягом 15 хвилин. Реакційну суміш перемішували додатково 10 хвилин, а потім вилили з перемішуванням на 125 мл роздробленого льоду з осадженням білої твердої речовини. Тверду речовину виділили за допомогою фільтрації та промили водою. Тверду речовину розчинили в тетрагідрофурані (40 мл) і додали водний 30% розчин гідроксиду амонію (8,0 мл). Реакційну суміш перемішували протягом 10 хвилин і концентрували під зниженим тиском з осадженням білої твердої речовини. Тверду речовину виділили за допомогою фільтрації та промили водою з одержанням 4,6 г названої сполуки у вигляді твердої речовини. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,87 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 4,75 (br s, 2H), 2,61 (s, 3H), 2,41 (s, 3H).

Етап В: Одержання 4-ціано-2,5-диметилбензолсульфонаміду

До розчину 4-бром-2,5-диметилбензолсульфонаміду (4,6 г, 22 ммоль, продукт Етапу А) у N-метилпіролідіноні (30 мл) додали ціанід міді (2,5 г, 28 ммоль) і реакційну суміш нагрівали при 200°C протягом 30 хвилин. Реакції потім дозволили охолонути та вилили в 200 мл роздробленого льоду з осадженням твердої речовини. До даної суміші додали дихлорметан

(500 мл) і суміш нагрівали з розчиненням білої твердої речовини. Суміш потім відфільтрували для видалення будь-яких нерозчинених твердих речовин, фази розділили та дихлорметан відмили водою (2 x 100 мл), висушили над сульфатом магнію та випарили під зниженим тиском з одержанням масла. Масло розчинили в тетрагідрофурані (30 мл) і воді (30 мл) і розчин

концентрували під зниженим тиском з осадженням твердої речовини. Дану тверду речовину виділили фільтрацією та промили водою з одержанням 2,5 г названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,98 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 4,89 (br s, 2H), 2,66 (s, 3H), 2,58 (s, 3H).

Етап C: Одержання 8-хлор-N-[(4-ціано-2,5-диметилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

До розчину 8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбонової кислоти (2,5 г, 9,5 ммоль, отриманої, як описано в Прикладі 1, Етап C) у t-бутанолі (70 мл) і дихлорметані (70 мл) додали 4-(диметиламіно)піридин (3,47 г, 28,4 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлорид (4,54 г, 23,7 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 15 хвилин, після чого додали 4-ціано-2,5-диметилбензолсульфонамід (1,85 г, 8,85 ммоль) і продовжили перемішування протягом ночі при кімнатній температурі. Потім додали дихлорметан (200 мл), суміш промили 1 N хлороводневою кислотою (3 x 100 мл), органічну фазу зібрали, та висушили над сульфатом магнію, та потім концентрували під зниженим тиском з одержанням твердої сполуки. Тверду речовину виділили фільтрацією, промили діетиловим ефіром і перекристалізували з гексану/етилацетату з одержанням 1,5 г названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді твердої речовини, т. пл. 228-229°C. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,97 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,54 (s, 1H), 2,71 (s, 3H), 2,63 (s, 3H).

Приклад синтезу 3

Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-етилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

Етап A: Одержання 2-хлор-5-етилбензолсульфонілхлориду

Хлорсульфонову кислоту (4,0 мл, 59 ммоль) охолодили до 0°C і додавали по краплях 1-хлор-4-етилбензол (1,0 мл, 7,5 ммоль) протягом 30 хвилин. Реакційну суміш перемішували протягом 45 хвилин при 0°C, виливали з перемішуванням на 125 мл роздробленого льоду та потім екстрагували етилацетатом (2 x 100 мл). Шари етилацетату об'єднали, промили водою (100 мл) і висушили над сульфатом магнію. Етилацетат концентрували під зниженим тиском з одержанням масла, визначеного як суміш ізомерів приблизно 1:1. Цю суміш піддавали хроматографії на силікагелі з елююванням градієнтом гексан/етилацетат з одержанням 0,41 г названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,97 (s, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 2,75 (q, 2H), 1,29 (t, 3H).

Етап B: Одержання 2-хлор-5-етилбензолсульфонаміду

До розчину 2-хлор-5-етилбензолсульфонілхлориду (0,41 г, 1,7 ммоль, продукт Етапу A) у тетрагідрофурані (30 мл) додали по краплях 30% гідроксид амонію (0,41 мл, 3,5 ммоль). Реакційну суміш перемішували 15 хвилин, протягом цього часу утворилася суспензія. До цієї суміші додали воду (10 мл), і тетрагідрофуран випарили під зниженим тиском з осадженням твердої речовини. Тверду речовину розчинили в діетиловому ефірі, висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском. Додали діетиловий ефір і гексан з осадженням твердої речовини. Тверду речовину виділили фільтрацією з одержанням 190 мг названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,95 (s, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,08 (br s, 2H), 2,71 (q, 2H), 1,25 (t, 3H).

Етап C: Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-етилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

До розчину 8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбонової кислоти (100 мг, 0,38 ммоль, отриманої, як описано в Прикладі 1 Етап C) у суміші 1:1 t-бутанолу (5 мл) і дихлорметану (5 мл) додали 4-(диметиламіно)піридин (138 мг, 1,1 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіімідгідрохлорид (182 мг, 0,95 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 15 хвилин, додали 2-хлор-5-етилбензолсульфонамід (74 мг, 0,34 ммоль) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім додали дихлорметан (100 мл), суміш промили 1 N хлороводневою кислотою (3 x 50 мл), і органічну фазу висушили над сульфатом магнію, та концентрували під зниженим тиском з одержанням твердої речовини. Тверду речовину промили діетиловим ефіром з одержанням 84 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді твердої речовини, т. пл. 214-215°C. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 10,12 (br s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,40 (s, 2H), 2,77 (q, 2H), 1,30 (t, 3H).

Приклад синтезу 4

Одержання 8-хлор-N-[(1-етил-3-метил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-

імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

Етап А: Одержання 1-етил-3-метил-1Н-піразол-4-сульфонаміду

До розчину 1-етил-3-метил-1Н-піразол-4-сульфонілхлориду (0,154 г, 0,73 ммоль, Matrix Scientific) у тетрагідрофурані (10 мл) додали по краплях водний розчин 30% гідроксиду амонію (0,20 мл, 1,7 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 1 години, додали воду (2 мл) і розчинник концентрували під зниженим тиском для осадження твердої речовини. Тверду речовину виділили фільтрацією, промили водою і висушили з одержанням 41 мг названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,80 (s, 1H), 4,75 (br s, 1H), 4,11 (q, 2H), 2,44 (s, 3H), 1,49 (t, 3H).

Етап В: Одержання 8-хлор-N-[(1-етил-3-метил-1Н-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

До розчину 8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбонової кислоти (63 мг, 0,24 ммоль, отриманої, як описано в Прикладі 1, Етапу С) у суміші 1:1 t-бутанолу (5 мл) і дихлорметану (5 мл) додали 4-(диметиламіно)піридин (88 мг, 0,71 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлорид (117 мг, 0,60 ммоль). Реакційну суміш перемішували 15 хвилин, після чого додали 1-етил-3-метил-1Н-піразол-4-сульфонамід (41 мг, 0,22 ммоль, продукт Етапу А) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Додали дихлорметан (100 мл) і суміш промили 1 Н хлороводною кислотою (3 x 50 мл). Органічну фазу відділили, висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском для одержання твердої речовини. Тверду речовину суспендували в суміші діетилового ефіру та гексану, відфільтрували та висушили з одержанням 25 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді твердої речовини, т. пл. 189-190 °С. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,85 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 4,14 (q, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,51 (t, 3H).

Приклад синтезу 5

Одержання 8-хлор-N-[(3-хлор-1-етил-1Н-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

Етап А: Одержання 1-етил-1Н-піразол-3-іламіну

До розчину карбонату калію (2,76 г, 20,0 ммоль) у воді (10 мл) додали етилгідразиноксалат (3,0 г, 20 ммоль), з наступним додаванням по краплях 2-хлоракрилонітрилу (1,6 мл, 20 ммоль) протягом 30 хвилин. Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин і потім нагрівали при 50°C протягом 2 годин. Реакційну суміш охолодили та екстрагували етилацетатом (2 x 100 мл). Етилацетат висушили над сульфатом магнію та випарили під зниженим тиском з одержанням масла. Масло піддали хроматографії на силікагелі з елююванням гексаном і етилацетатом в якості елюенту з одержанням 540 мг названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,12 (d, 1H), 5,57 (d, 1H), 3,96 (q, 2H), 3,59 (br s, 1H), 1,42 (t, 3H).

Етап В: Одержання 3-хлор-1-етил-1Н-піразолу

До розчину 1-етил-1Н-піразол-3-іламіну (0,54 г, 4,86 ммоль, продукт Етапу А) у концентрованій хлороводневій кислоті (5 мл) при 0°C додавали по краплях розчин нітриту натрію (369 мг, 5,35 ммоль) у воді (1 мл), при цьому підтримуючи температуру нижче 10°C. Реакційну суміш перемішували 30 хвилин, додавали по краплях розчин хлориду міді (I) у концентрованій хлороводневій кислоті (2 мл), і одержану в результаті реакційну суміш потім нагріли до 60°C. Каталітичну кількість хлориду міді додали при 60°C (ініціюючи виділення газу). Реакційну суміш перемішували протягом 5 хвилин, і потім вилили на 100 мл роздробленого льоду, що містив 50% гідроксид натрію (5 мол), і добре перемішали. Водну суміш екстрагували дихлорметаном (2 x 150 мл), і органічний шар відокремили, промили водою, висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском з одержанням 0,42 г названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,31 (d, 1H), 6,15 (d, 1H), 4,11 (q, 2H), 1,47 (t, 3H).

Етап С: Одержання 3-хлор-1-етил-1Н-піразол-4-сульфонілхлориду

3-хлор-1-етил-1Н-піразол (0,42 г, 3,2 ммоль, продукт Етапу В) додали до хлорсульфонової кислоти (2,0 мл, 30 ммоль) при кімнатній температурі, та суміш повільно нагрівали до 100°C, і потім гріли на 100-110°C протягом 2 годин. Реакційну суміш охолодили, вилили при перемішуванні на 150 мл роздробленого льоду й екстрагували в діетиловий ефір (2 x 100 мл). Ефірні екстракти об'єднали, промили водою (100 мл), висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском з одержанням 0,5 г названої сполуки у вигляді масла. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,00 (s, 1H), 4,20 (q, 2H), 1,56 (t, 3H).

Етап D: Одержання 3-хлор-1-етил-1Н-піразол-4-сульфонаміду

До розчину 3-хлор-1-етил-1Н-піразол-4-сульфонілхлориду (0,5 г, 2,2 ммоль, продукт Етапу D) у тетрагідрофурані (20 мл) додали по краплях 30% гідроксид амонію (3,0 мл, 24 ммоль). Реакційну суміш нагрівали до кипіння апаратом для сушіння струменем теплого повітря та потім перемішували протягом 30 хвилин. Тетрагідрофуран видалили під зниженим тиском, додали

воду (50 мл), реакційну суміш екстрагували в етилацетат (2 x 100 мл). Етилацетат висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском для одержання твердої речовини. Тверду речовину промили гексаном і висушили з одержанням 282 мг названої сполуки. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,84 (s, 1H), 4,94 (br s, 1H), 4,15 (q, 2H), 1,51 (t, 3H).

5 Етап Е: Одержання 8-хлор-N-[(3-хлор-1-етил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

До розчину 8-хлор-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбонової кислоти (110 мг, 0,42 ммоль, отриманої, як описано в Прикладі 1 Етап С) у суміші 1:1 t-бутанолу (5 мл) і дихлорметану (5 мл) додали 4-(диметиламіно)піридин (152 мг, 1,25 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлорид (96 мг, 0,5 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 15 хвилин, після чого додали 3-хлор-1-етил-1H-піразол-4-сульфонамід (81 мг, 0,38 ммоль, продукт Етапу D) і перемішування продовжували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім додали дихлорметан (100 мл) і суміш екстрагували 1 Н хлороводневою кислотою (3 x 50 мл). Відділені органічні фази об'єднали, висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском для одержання твердої речовини. Тверду речовину суспендували в суміші діетилового ефіру та гексану та відфільтрували з одержанням 85 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді твердої речовини, т. пл. 184-185°C. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,96 (br s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,54 (s, 1H), 4,17 (q, 2H), 1,54 (t, 3H).

20 Приклад синтезу 6

Одержання 8-бром-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

Етап А: Одержання 8-бром-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбонової кислоти

До розчину 2-аміно-3-бром-5-(трифторметил)піридину (10,0 г, 41,5 ммоль) у 1,2-диметоксетані (300 мл) при кімнатній температурі додали по краплях етилбромпіруват (9,889 г, 45,64 ммоль). Реакційну суміш нагрівали до флегми протягом 18 годин. 1,2-диметоксетан видалили під зниженим тиском і залишкову тверду речовину перекристалізували з 1-хлорбутану. Тверду речовину виділили фільтрацією та висушили з одержанням не зовсім білої твердої речовини, етилового складного ефіру 8-бром-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбонової кислоти (11,044 г).

Тверду речовину, отриману вище, розчинили в тетрагідрофурані (150 мл) і додали розчин LiOH (2,353 г, 98,29 ммоль) у воді (100 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі 4 години. Тетрагідрофуран видалили під зниженим тиском для одержання водного розчину, який охолодили до 5°C. По краплях додавали розведену HCl, доки не одержали pH < 5,0. Через кілька хвилин тверда речовина почала осаджуватися з розчину. Тверду речовину зібрали фільтрацією, раз промили водою (50 мл) і сушили у вакуумній печі протягом 18 годин при 80°C з одержанням 8,632 г названої сполуки у вигляді твердої речовини. ^1H ЯМР ($\text{dms}-d_6$) δ 13,17 (br s, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,03 (s, 1H).

40 Етап В: Одержання 8-бром-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

До продукту Етапу А (200 мг, 0,647 ммоль) додали розчин 4-(диметиламіно)піридину (237 мг, 1,94 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлорид (309 мг, 1,62 ммоль) у суміші 1:1 t-бутанолу (5 мл) і дихлорметану (5 мл). Реакційну суміш перемішували протягом 15 хвилин, додали 2-хлор-5-метоксибензолсульфонамід (129 мг, 0,582 ммоль) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім додали дихлорметан (200 мл), суміш екстрагували 1 Н хлороводневою кислотою (3 x 100 мл) і відділені органічні фази об'єднали, висушили над сульфатом магнію і концентрували під зниженим тиском для одержання твердої речовини. Тверду речовину промили діетиловим ефіром з одержанням 234 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді білої твердої речовини, т. пл. 191-192°C. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 10,1 (br s, 1H), 8,51 (s, 1H), 8,30 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,08 (dd, 1H) 3,91 (s, 3H).

Приклад синтезу 7

Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-3-метил-6-(трифторметил)імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксаміду

55 Етап А: Одержання етилового складного ефіру 3-бром-2-оксомасляної кислоти

2-оксомасляну кислоту (10,0 г, 97,2 ммоль) розчинили в етанолі (100 мл) і додали моногідрат p-толуолсульфонової кислоти (0,1 г). Реакційну суміш нагрівали до флегми протягом 48 годин. Після охолодження реакційної суміші до кімнатної температури видалили під зниженим тиском етанол з одержанням 11,4 г етилового складного ефіру 2-оксомасляної кислоти.

Етиловий складний ефір 2-оксомасляної кислоти, одержаний вище, розчинили в хлороформі (100 мл) і по краплях додали бром (20,964 г, 131,19 ммоль) при кімнатній температурі. Реакційну суміш залишили перемішуватися протягом 18 годин. Концентрування реакційної суміші під зниженим тиском дало 12,0 г названої сполуки у вигляді жовтогарячого масла. ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 4,39 (q, 2H), 4,32 (q, 1H), 1,88 (d, 3H), 1,39 (t, 3H).

Етап В: Одержання 8-хлор-3-метил-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбонової кислоти

До розчину 2-аміно-3-хлор-5-(трифторметил)піридину (11,3 г, 57,5 ммоль) у діоксані (200 мл) при кімнатній температурі додали по краплях етиловий складний ефір 3-бром-2-оксомасляної кислоти (12,017 г, 57,49 ммоль, продукт Етапу А). Реакційну суміш нагрівали до флегми протягом 24 годин, охолодили та видалили діоксан під зниженим тиском. Хроматографія на силікагелі з елюванням градієнтом гексану/етилацетату дала 17,3 г етилового складного ефіру 8-хлор-3-метил-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбонової кислоти у вигляді твердої речовини.

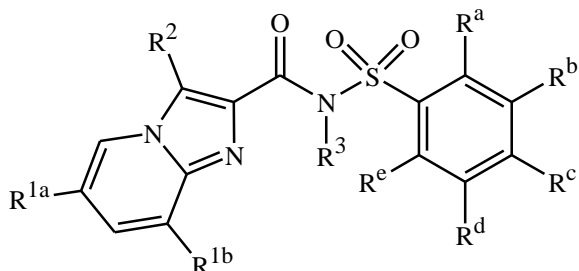
Тверду речовину, отриману вище, розчинили в тетрагідрофурані (100 мл) і додали розчин LiOH (3,365 г, 140,8 ммоль) у воді (50 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 18 годин. Тетрагідрофуран видалили під зниженим тиском з одержанням водного розчину, який охолодили до 5°C . Додавали по краплях розведену HCl , доки не досягли $\text{pH} < 5,0$. Через кілька хвилин почала осаджуватися тверда речовина. Тверду речовину зібрали фільтрацією, промили водою (50 мл) і сушили при 80°C у вакуумній печі протягом 18 годин з одержанням 15,7 г твердої речовини. ^1H ЯМР (dmsO-d_6) δ 13,1 (br s, 1H), 8,84 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 2,82 (s, 3H).

Етап С: Одержання 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксибеніл)сульфоніл]-3-метил-6-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-карбоксаміду

До карбонової кислоти, отриманої на Етапі В (200 мг, 0,72 ммоль), додали розчин 4-(диметиламіно)піридину (262 мг, 2,15 ммоль) і 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлорид (344 мг, 1,79 ммоль) у суміші розчинників 1:1 t-бутанолу (5 мл) і дихлорметану (5 мл). Реакційну суміш перемішували 15 хвилин, додали 2-хлор-5-метоксибензолсульфонамід (143 мг, 0,65 ммоль) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім додали дихлорметан (200 мл), суміш екстрагували 1 N хлороводневою кислотою (3 x 100 мл), а розділені органічні шари об'єднали, висушили над сульфатом магнію та концентрували під зниженим тиском з одержанням твердої речовини. Тверду речовину промили діетиловим ефіром з одержанням 118 мг названої сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді білої твердої речовини, т. пл. $222-223^\circ\text{C}$. ^1H ЯМР (dmsO-d_6) δ 10,0 (br s, 1H), 8,94 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,30 (dd, 1H), 3,87 (s, 3H), 2,71 (s, 3H).

За допомогою процедур, описаних в даному документі, разом зі способами, відомими в даному рівні техніки, можна одержати наступні сполуки Таблиць 1-22. У таблицях використовували наступні аббревіатури: Me означає метил, Et означає етил, OMe означає метокси, SMe означає метилтіо та NMe_2 означає диметиламіно.

Таблица 1



R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Cl , R^2 і R^3 являють собою H

R^a	R^b	R^c	R^d	R^e	R^a	R^b	R^c	R^d	R^e
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Me	H	H	H
H	Et	H	H	H	Me	Et	H	H	H
H	F	H	H	H	Me	F	H	H	H
H	Cl	H	H	H	Me	Cl	H	H	H
H	Br	H	H	H	Me	Br	H	H	H
H	CF_3	H	H	H	Me	CF_3	H	H	H
H	ціано	H	H	H	Me	ціано	H	H	H
H	OMe	H	H	H	Me	OMe	H	H	H
H	SMe	H	H	H	Me	SMe	H	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	Me	H	H	H	Cl	Me	H	H	H
F	Et	H	H	H	Cl	Et	H	H	H
F	F	H	H	H	Cl	F	H	H	H
F	Cl	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H
F	Br	H	H	H	Cl	Br	H	H	H
F	CF_3	H	H	H	Cl	CF_3	H	H	H
F	ціано	H	H	H	Cl	ціано	H	H	H
F	OMe	H	H	H	Cl	OMe	H	H	H
F	SMe	H	H	H	Cl	SMe	H	H	H
Br	H	H	H	H	CF_3	H	H	H	H
Br	Me	H	H	H	CF_3	Me	H	H	H
Br	Et	H	H	H	CF_3	Et	H	H	H
Br	F	H	H	H	CF_3	F	H	H	H
Br	Cl	H	H	H	CF_3	Cl	H	H	H
Br	Br	H	H	H	CF_3	Br	H	H	H
Br	CF_3	H	H	H	CF_3	CF_3	H	H	H
Br	ціано	H	H	H	CF_3	ціано	H	H	H
Br	OMe	H	H	H	CF_3	OMe	H	H	H
Br	SMe	H	H	H	CF_3	SMe	H	H	H
ціано	H	H	H	H	ціано	Br	H	H	H
ціано	Me	H	H	H	ціано	CF_3	H	H	H
ціано	Et	H	H	H	ціано	ціано	H	H	H
ціано	F	H	H	H	ціано	OMe	H	H	H
ціано	Cl	H	H	H	ціано	SMe	H	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Et	H	H	Me	H	Et	H	H
H	H	F	H	H	Me	H	F	H	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Br	H	H	Me	H	Br	H	H
H	H	CF_3	H	H	Me	H	CF_3	H	H
H	H	ціано	H	H	Me	H	ціано	H	H
H	H	OMe	H	H	Me	H	OMe	H	H
H	H	SMe	H	H	Me	H	SMe	H	H

Таблиця 1 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Et	H	H	Cl	H	Et	H	H
F	H	F	H	H	Cl	H	F	H	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Br	H	H	Cl	H	Br	H	H
F	H	CF ₃	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H
F	H	ціано	H	H	Cl	H	ціано	H	H
F	H	OMe	H	H	Cl	H	OMe	H	H
F	H	SMe	H	H	Cl	H	SMe	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Et	H	H	CF ₃	H	Et	H	H
Br	H	F	H	H	CF ₃	H	F	H	H
Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Br	H	H	CF ₃	H	Br	H	H
Br	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H
Br	H	ціано	H	H	CF ₃	H	ціано	H	H
Br	H	OMe	H	H	CF ₃	H	OMe	H	H
Br	H	SMe	H	H	CF ₃	H	SMe	H	H
ціано	H	H	H	H	ціано	H	Br	H	H
ціано	H	Me	H	H	ціано	H	CF ₃	H	H
ціано	H	Et	H	H	ціано	H	ціано	H	H
ціано	H	F	H	H	ціано	H	OMe	H	H
ціано	H	Cl	H	H	ціано	H	SMe	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	Me	H	Me	H	H	Me	H
H	H	H	Et	H	Me	H	H	Et	H
H	H	H	F	H	Me	H	H	F	H
H	H	H	Cl	H	Me	H	H	Cl	H
H	H	H	Br	H	Me	H	H	Br	H
H	H	H	CF ₃	H	Me	H	H	CF ₃	H
H	H	H	ціано	H	Me	H	H	ціано	H
H	H	H	OMe	H	Me	H	H	OMe	H
H	H	H	SMe	H	Me	H	H	SMe	H
H	H	H	CO ₂ Me	H	Me	H	H	CO ₂ Me	H
H	H	H	C(O)Me	H	Me	H	H	C(O)Me	H
H	H	H	NMe ₂	H	Me	H	H	NMe ₂	H
H	H	H	нітро	H	Me	H	H	нітро	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	Me	H	Cl	H	H	Me	H
F	H	H	Et	H	Cl	H	H	Et	H
F	H	H	F	H	Cl	H	H	F	H
F	H	H	Cl	H	Cl	H	H	Cl	H
F	H	H	Br	H	Cl	H	H	Br	H
F	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	CF ₃	H
F	H	H	ціано	H	Cl	H	H	ціано	H
F	H	H	OMe	H	Cl	H	H	OMe	H
F	H	H	SMe	H	Cl	H	H	SMe	H
F	H	H	CO ₂ Me	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
F	H	H	C(O)Me	H	Cl	H	H	C(O)Me	H
F	H	H	NMe ₂	H	Cl	H	H	NMe ₂	H
F	H	H	нітро	H	Cl	H	H	нітро	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	Me	H
Br	H	H	Et	H	CF ₃	H	H	Et	H

Таблиця 1 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
Br	H	H	F	H	CF ₃	H	H	F	H
Br	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H	Cl	H
Br	H	H	Br	H	CF ₃	H	H	Br	H
Br	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H
Br	H	H	ціано	H	CF ₃	H	H	ціано	H
Br	H	H	OMe	H	CF ₃	H	H	OMe	H
Br	H	H	SMe	H	CF ₃	H	H	SMe	H
Br	H	H	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H
Br	H	H	C(O)Me	H	CF ₃	H	H	C(O)Me	H
Br	H	H	NMe ₂	H	CF ₃	H	H	NMe ₂	H
Br	H	H	нітро	H	CF ₃	H	H	нітро	H
ціано	H	H	H	H	ціано	H	H	ціано	H
ціано	H	H	Me	H	ціано	H	H	OMe	H
ціано	H	H	Et	H	ціано	H	H	SMe	H
ціано	H	H	F	H	ціано	H	H	CO ₂ Me	H
ціано	H	H	Cl	H	ціано	H	H	C(O)Me	H
ціано	H	H	Br	H	ціано	H	H	NMe ₂	H
ціано	H	H	CF ₃	H	ціано	H	H	нітро	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	H	Me	Me	H
H	H	Me	Et	H	Me	H	Me	Et	H
H	H	Me	F	H	Me	H	Me	F	H
H	H	Me	Cl	H	Me	H	Me	Cl	H
H	H	Me	Br	H	Me	H	Me	Br	H
H	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	CF ₃	H
H	H	Me	ціано	H	Me	H	Me	ціано	H
H	H	Me	OMe	H	Me	H	Me	OMe	H
H	H	Me	SMe	H	Me	H	Me	SMe	H
H	H	Me	CO ₂ Me	H	Me	H	Me	CO ₂ Me	H
H	H	Me	C(O)Me	H	Me	H	Me	C(O)Me	H
H	H	Me	NMe ₂	H	Me	H	Me	NMe ₂	H
H	H	Me	нітро	H	Me	H	Me	нітро	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Me	Me	H	Cl	H	Me	Me	H
F	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	Et	H
F	H	Me	F	H	Cl	H	Me	F	H
F	H	Me	Cl	H	Cl	H	Me	Cl	H
F	H	Me	Br	H	Cl	H	Me	Br	H
F	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	CF ₃	H
F	H	Me	ціано	H	Cl	H	Me	ціано	H
F	H	Me	OMe	H	Cl	H	Me	OMe	H
F	H	Me	SMe	H	Cl	H	Me	SMe	H
F	H	Me	CO ₂ Me	H	Cl	H	Me	CO ₂ Me	H
F	H	Me	C(O)Me	H	Cl	H	Me	C(O)Me	H
F	H	Me	NMe ₂	H	Cl	H	Me	NMe ₂	H
F	H	Me	нітро	H	Cl	H	Me	нітро	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Me	Me	H	CF ₃	H	Me	Me	H
Br	H	Me	Et	H	CF ₃	H	Me	Et	H
Br	H	Me	F	H	CF ₃	H	Me	F	H
Br	H	Me	Cl	H	CF ₃	H	Me	Cl	H
Br	H	Me	Br	H	CF ₃	H	Me	Br	H
Br	H	Me	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	CF ₃	H
Br	H	Me	ціано	H	CF ₃	H	Me	ціано	H
Br	H	Me	OMe	H	CF ₃	H	Me	OMe	H
Br	H	Me	SMe	H	CF ₃	H	Me	SMe	H

Таблиця 1 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
Br	H	Me	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Me	CO ₂ Me	H
Br	H	Me	C(O)Me	H	CF ₃	H	Me	C(O)Me	H
Br	H	Me	NMe ₂	H	CF ₃	H	Me	NMe ₂	H
Br	H	Me	нітро	H	CF ₃	H	Me	нітро	H
ціано	H	Me	H	H	ціано	H	Me	ціано	H
ціано	H	Me	Me	H	ціано	H	Me	OMe	H
ціано	H	Me	Et	H	ціано	H	Me	SMe	H
ціано	H	Me	F	H	ціано	H	Me	CO ₂ Me	H
ціано	H	Me	Cl	H	ціано	H	Me	C(O)Me	H
ціано	H	Me	Br	H	ціано	H	Me	NMe ₂	H
ціано	H	Me	CF ₃	H	ціано	H	Me	нітро	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Cl	Me	H	Me	H	Cl	Me	H
H	H	Cl	Et	H	Me	H	Cl	Et	H
H	H	Cl	F	H	Me	H	Cl	F	H
H	H	Cl	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H
H	H	Cl	Br	H	Me	H	Cl	Br	H
H	H	Cl	CF ₃	H	Me	H	Cl	CF ₃	H
H	H	Cl	ціано	H	Me	H	Cl	ціано	H
H	H	Cl	OMe	H	Me	H	Cl	OMe	H
H	H	Cl	SMe	H	Me	H	Cl	SMe	H
H	H	Cl	CO ₂ Me	H	Me	H	Cl	CO ₂ Me	H
H	H	Cl	C(O)Me	H	Me	H	Cl	C(O)Me	H
H	H	Cl	NMe ₂	H	Me	H	Cl	NMe ₂	H
H	H	Cl	нітро	H	Me	H	Cl	нітро	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Cl	Me	H	Cl	H	Cl	Me	H
F	H	Cl	Et	H	Cl	H	Cl	Et	H
F	H	Cl	F	H	Cl	H	Cl	F	H
F	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H
F	H	Cl	Br	H	Cl	H	Cl	Br	H
F	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	Cl	CF ₃	H
F	H	Cl	ціано	H	Cl	H	Cl	ціано	H
F	H	Cl	OMe	H	Cl	H	Cl	OMe	H
F	H	Cl	SMe	H	Cl	H	Cl	SMe	H
F	H	Cl	CO ₂ Me	H	Cl	H	Cl	CO ₂ Me	H
F	H	Cl	C(O)Me	H	Cl	H	Cl	C(O)Me	H
F	H	Cl	NMe ₂	H	Cl	H	Cl	NMe ₂	H
F	H	Cl	нітро	H	Cl	H	Cl	нітро	H
Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Cl	Me	H	CF ₃	H	Cl	Me	H
Br	H	Cl	Et	H	CF ₃	H	Cl	Et	H
Br	H	Cl	F	H	CF ₃	H	Cl	F	H
Br	H	Cl	Cl	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H
Br	H	Cl	Br	H	CF ₃	H	Cl	Br	H
Br	H	Cl	CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	CF ₃	H
Br	H	Cl	ціано	H	CF ₃	H	Cl	ціано	H
Br	H	Cl	OMe	H	CF ₃	H	Cl	OMe	H
Br	H	Cl	SMe	H	CF ₃	H	Cl	SMe	H
Br	H	Cl	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Cl	CO ₂ Me	H
Br	H	Cl	C(O)Me	H	CF ₃	H	Cl	C(O)Me	H
Br	H	Cl	NMe ₂	H	CF ₃	H	Cl	NMe ₂	H
Br	H	Cl	нітро	H	CF ₃	H	Cl	нітро	H
ціано	H	Cl	H	H	ціано	H	Cl	ціано	H
ціано	H	Cl	Me	H	ціано	H	Cl	OMe	H
ціано	H	Cl	Et	H	ціано	H	Cl	SMe	H

Таблиця 1 (продовження)

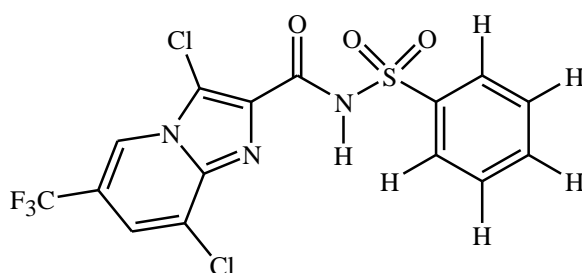
R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
ціано	H	Cl	F	H	ціано	H	Cl	CO ₂ Me	H
ціано	H	Cl	Cl	H	ціано	H	Cl	C(O)Me	H
ціано	H	Cl	Br	H	ціано	H	Cl	NMe ₂	H
ціано	H	Cl	CF ₃	H	ціано	H	Cl	нітро	H
H	H	ціано	H	H	Me	H	ціано	H	H
H	H	ціано	Me	H	Me	H	ціано	Me	H
H	H	ціано	Et	H	Me	H	ціано	Et	H
H	H	ціано	F	H	Me	H	ціано	F	H
H	H	ціано	Cl	H	Me	H	ціано	Cl	H
H	H	ціано	Br	H	Me	H	ціано	Br	H
H	H	ціано	CF ₃	H	Me	H	ціано	CF ₃	H
H	H	ціано	ціано	H	Me	H	ціано	ціано	H
H	H	ціано	OMe	H	Me	H	ціано	OMe	H
H	H	ціано	SMe	H	Me	H	ціано	SMe	H
H	H	ціано	CO ₂ Me	H	Me	H	ціано	CO ₂ Me	H
H	H	ціано	C(O)Me	H	Me	H	ціано	C(O)Me	H
H	H	ціано	NMe ₂	H	Me	H	ціано	NMe ₂	H
H	H	ціано	нітро	H	Me	H	ціано	нітро	H
F	H	ціано	H	H	Cl	H	ціано	H	H
F	H	ціано	Me	H	Cl	H	ціано	Me	H
F	H	ціано	Et	H	Cl	H	ціано	Et	H
F	H	ціано	F	H	Cl	H	ціано	F	H
F	H	ціано	Cl	H	Cl	H	ціано	Cl	H
F	H	ціано	Br	H	Cl	H	ціано	Br	H
F	H	ціано	CF ₃	H	Cl	H	ціано	CF ₃	H
F	H	ціано	ціано	H	Cl	H	ціано	ціано	H
F	H	ціано	OMe	H	Cl	H	ціано	OMe	H
F	H	ціано	SMe	H	Cl	H	ціано	SMe	H
F	H	ціано	CO ₂ Me	H	Cl	H	ціано	CO ₂ Me	H
F	H	ціано	C(O)Me	H	Cl	H	ціано	C(O)Me	H
F	H	ціано	NMe ₂	H	Cl	H	ціано	NMe ₂	H
F	H	ціано	нітро	H	Cl	H	ціано	нітро	H
Br	H	ціано	H	H	CF ₃	H	ціано	H	H
Br	H	ціано	Me	H	CF ₃	H	ціано	Me	H
Br	H	ціано	Et	H	CF ₃	H	ціано	Et	H
Br	H	ціано	F	H	CF ₃	H	ціано	F	H
Br	H	ціано	Cl	H	CF ₃	H	ціано	Cl	H
Br	H	ціано	Br	H	CF ₃	H	ціано	Br	H
Br	H	ціано	CF ₃	H	CF ₃	H	ціано	CF ₃	H
Br	H	ціано	ціано	H	CF ₃	H	ціано	ціано	H
Br	H	ціано	OMe	H	CF ₃	H	ціано	OMe	H
Br	H	ціано	SMe	H	CF ₃	H	ціано	SMe	H
Br	H	ціано	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	ціано	CO ₂ Me	H
Br	H	ціано	C(O)Me	H	CF ₃	H	ціано	C(O)Me	H
Br	H	ціано	NMe ₂	H	CF ₃	H	ціано	NMe ₂	H
Br	H	ціано	нітро	H	CF ₃	H	ціано	нітро	H
ціано	H	ціано	H	H	ціано	H	ціано	ціано	H
ціано	H	ціано	Me	H	ціано	H	ціано	OMe	H
ціано	H	ціано	Et	H	ціано	H	ціано	SMe	H
ціано	H	ціано	F	H	ціано	H	ціано	CO ₂ Me	H
ціано	H	ціано	Cl	H	ціано	H	ціано	C(O)Me	H
ціано	H	ціано	Br	H	ціано	H	ціано	NMe ₂	H
ціано	H	ціано	CF ₃	H	ціано	H	ціано	нітро	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	H	Me	Me	H	H	H	Me
H	H	H	H	F	Me	H	H	H	F

Таблиця 1 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
H	H	H	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
H	H	H	H	Br	Me	H	H	H	Br
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	H	Me	Cl	H	H	H	Me
F	H	H	H	F	Cl	H	H	H	F
F	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H	Cl
F	H	H	H	Br	Cl	H	H	H	Br
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H	Me
Br	H	H	H	F	CF ₃	H	H	H	F
Br	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	Cl
Br	H	H	H	Br	CF ₃	H	H	H	Br
ціано	H	H	H	H	ціано	H	H	H	F
ціано	H	H	H	Me	ціано	H	H	H	Cl
Cl	H	H	OCF ₃	H	ціано	H	H	H	Br
OCF ₃	H	H	Cl	H					

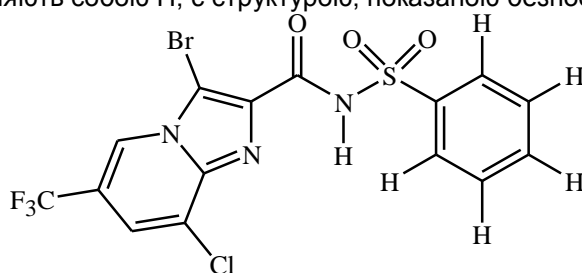
Таблиця 2

- Таблиця 2 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R² являє собою Cl.
- 5 Наприклад, перша сполука в Таблиці 2, де R^{1a} являє собою CF₃, R^{1b} являє собою Cl, R² являє собою Cl, R³ і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



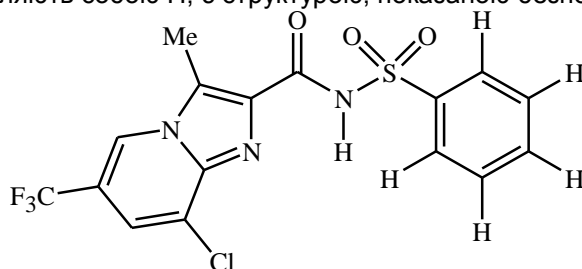
Таблиця 3

- Таблиця 3 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R² являє собою Br.
- 10 Наприклад, перша сполука в Таблиці 3, де R^{1a} являє собою CF₃, R^{1b} являє собою Cl, R² являє собою Br, R³ і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



Таблиця 4

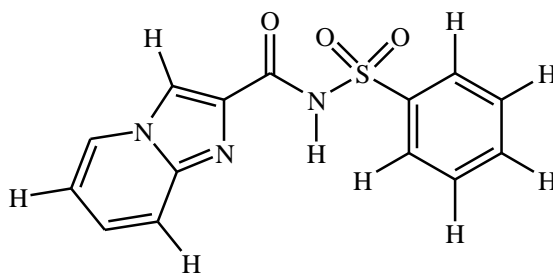
- Таблиця 4 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R² являє собою Me.
- 15 Наприклад, перша сполука в Таблиці 4, де R^{1a} являє собою CF₃, R^{1b} являє собою Cl, R² являє собою Me, R³ і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



Таблиця 5

Таблиця 5 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1a} і R^{1b} являють собою H. Наприклад, перша сполука в Таблиці 5, де R^{1a} являє собою H, R^{1b} являє собою H, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.

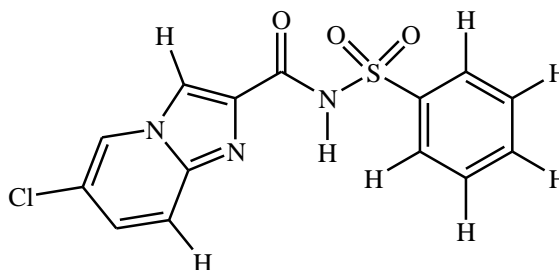
5



Таблиця 5а

Таблиця 5а складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1a} являє собою Cl, і R^{1b} являє собою H. Наприклад, перша сполука в Таблиці 5а, де R^{1a} являє собою Cl, R^{1b} являє собою H, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.

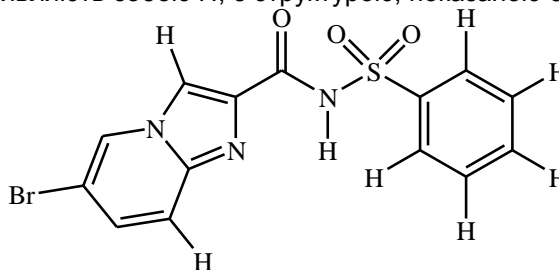
10



Таблиця 5b

Таблиця 5b складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1a} являє собою Br, і R^{1b} являє собою H. Наприклад, перша сполука в Таблиці 5b, де R^{1a} являє собою Br, R^{1b} являє собою H, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.

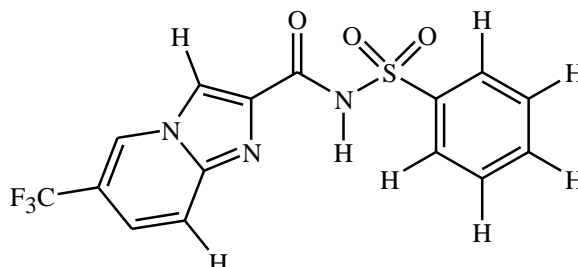
15



Таблиця 5с

Таблиця 5с складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1b} являє собою H. Наприклад, перша сполука в Таблиці 5с, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою H, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.

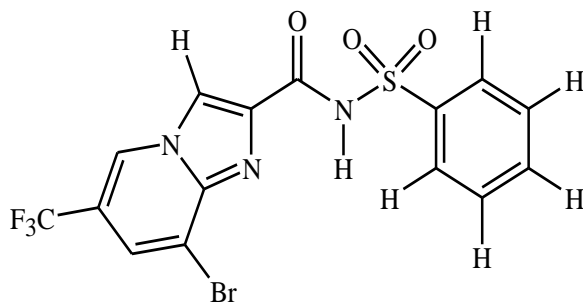
20



25

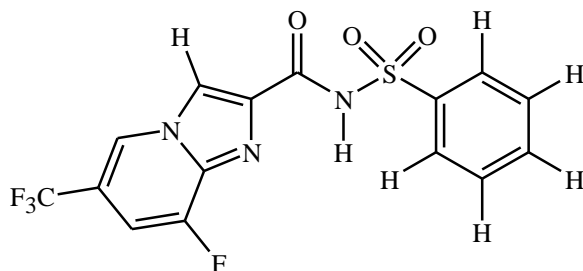
Таблиця 6

Таблиця 6 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1b} являє собою Br. Наприклад, перша сполука в Таблиці 6, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Br, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



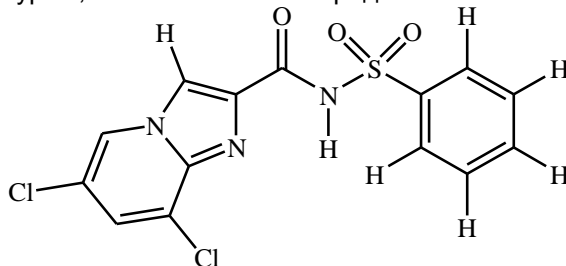
Таблиця 6а

- Таблиця 6 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1b} являє собою F. Наприклад, перша сполука в Таблиці 6, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою F, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



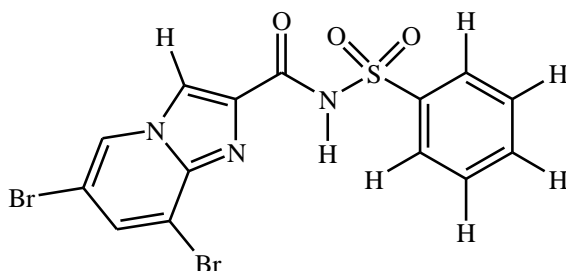
Таблиця 7

- Таблиця 7 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1a} і R^{1b} являють собою Cl. Наприклад, перша сполука в Таблиці 7, де R^{1a} і R^{1b} являють собою Cl, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



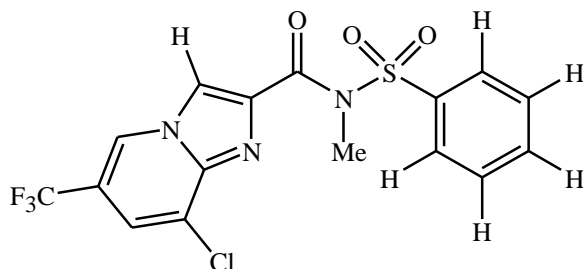
Таблиця 8

- Таблиця 8 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^{1a} і R^{1b} являють собою Br. Наприклад, перша сполука в Таблиці 8, де R^{1a} і R^{1b} являють собою Br, і R^2 , R^3 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



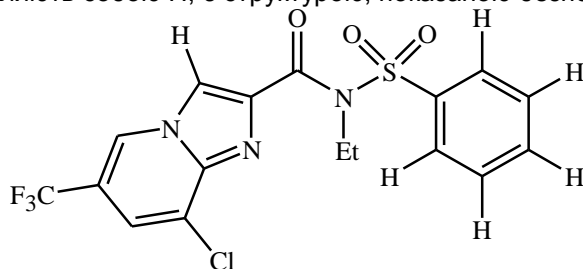
Таблиця 9

- Таблиця 9 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^3 являє собою Me. Наприклад, перша сполука в Таблиці 9, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Cl, R^3 являє собою Me, і R^2 і R^a - R^e являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



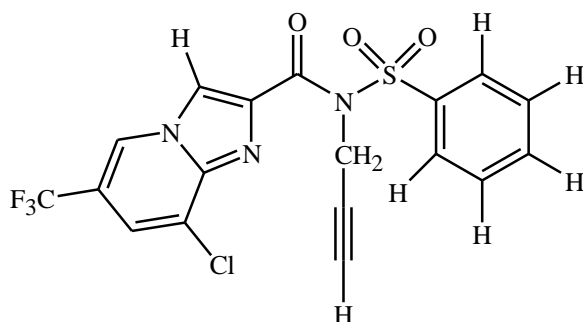
Таблиця 10

Таблиця 10 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^3 являє собою Et. Наприклад, перша сполука в Таблиці 10, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Cl, R^3 являє собою Et, і R^2 і $R^a - R^e$ являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



Таблиця 11

Таблиця 11 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^3 являє собою пропаргіл (тобто $CH_2C\equiv CH$). Наприклад, перша сполука в Таблиці 11, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Cl, R^3 являє собою пропаргіл, і R^2 і $R^a - R^e$ являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.



Таблиця 12

Таблиця 12 складена так само, як і Таблиця 1, за винятком того, що R^3 являє собою бензил (тобто $CH_2C_6H_5$). Наприклад, перша сполука в Таблиці 12, де R^{1a} являє собою CF_3 , R^{1b} являє собою Cl, R^3 являє собою бензил, і R^2 і $R^a - R^e$ являють собою H, є структурою, показаною безпосередньо нижче.

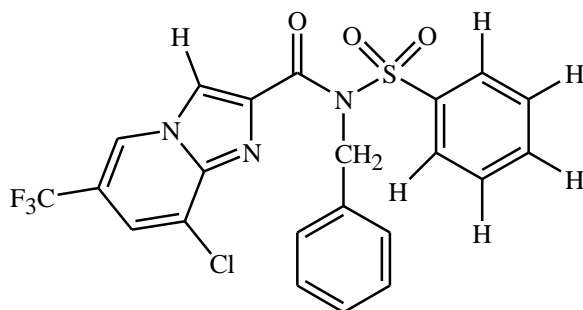
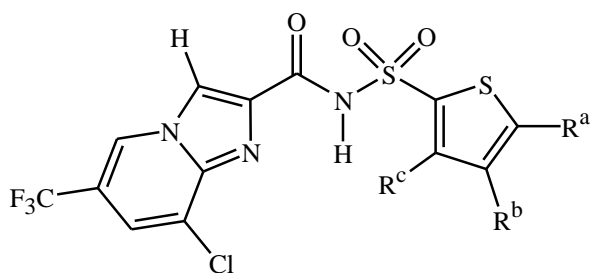
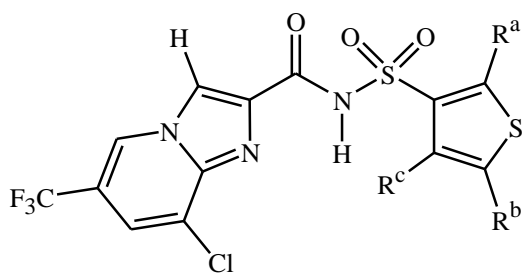


Таблица 13



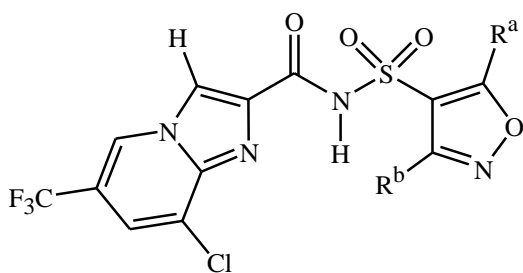
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br
H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			
Br	H	Br	Et	H	Br			
Br	Me	H	Et	Me	H			
Br	Me	Me	Et	Me	Me			
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl			
Br	Me	Br	Et	Me	Br			
Br	Et	H	Et	Et	H			
Br	Et	Me	Et	Et	Me			
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl			
Br	Et	Br	Et	Et	Br			
Br	Cl	H	Et	Cl	H			
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me			
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl			
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br			

Таблица 14



R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			
Et	H	Cl	Br	H	Cl			
Et	Me	H	Br	Me	H			
Et	Me	Me	Br	Me	Me			
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl			
Et	Et	H	Br	Et	H			
Et	Et	Me	Br	Et	Me			
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl			

Таблица 15



R ^a	R ^b	R ^a	R ^b	R ^a	R ^b
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

Таблица 16

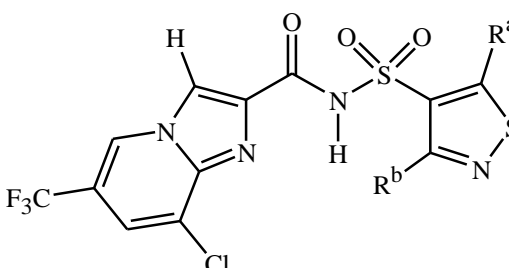
								
R ^a		R ^b	R ^a		R ^b	R ^a		R ^b
H		H	Me		H	Cl		H
H		Me	Me		Me	Cl		Me
H		Cl	Me		Cl	Cl		Cl

Таблица 17

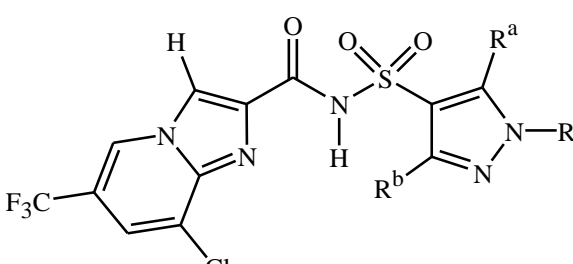
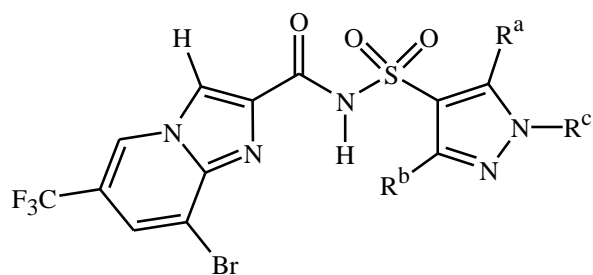
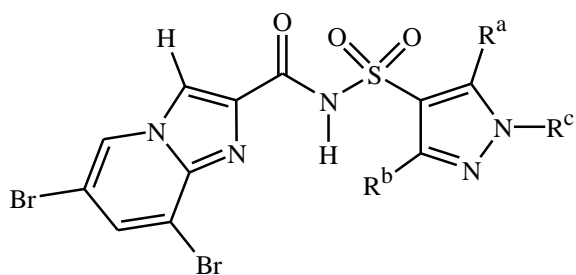
								
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	i-Pr	Me	H	i-Pr	Cl	H	i-Pr
H	H	n-Pr	Me	H	n-Pr	Cl	H	n-Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	i-Pr	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr
Br	H	n-Pr	H	Me	n-Pr	Me	Me	n-Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	i-Pr	Br	Me	i-Pr	H	Cl	i-Pr
Cl	Me	n-Pr	Br	Me	n-Pr	H	Cl	n-Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr	Cl	Cl	i-Pr	Br	Cl	i-Pr
Me	Cl	n-Pr	Cl	Cl	n-Pr	Br	Cl	n-Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	i-Pr	Me	Br	i-Pr	Cl	Br	i-Pr
H	Br	n-Pr	Me	Br	n-Pr	Cl	Br	n-Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	n-Pr						

Таблица 17a



R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	i-Pr	Me	H	i-Pr	Cl	H	i-Pr
H	H	n-Pr	Me	H	n-Pr	Cl	H	n-Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	i-Pr	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr
Br	H	n-Pr	H	Me	n-Pr	Me	Me	n-Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	i-Pr	Br	Me	i-Pr	H	Cl	i-Pr
Cl	Me	n-Pr	Br	Me	n-Pr	H	Cl	n-Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr	Cl	Cl	i-Pr	Br	Cl	i-Pr
Me	Cl	n-Pr	Cl	Cl	n-Pr	Br	Cl	n-Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	i-Pr	Me	Br	i-Pr	Cl	Br	i-Pr
H	Br	n-Pr	Me	Br	n-Pr	Cl	Br	n-Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	n-Pr						

Таблица 17b

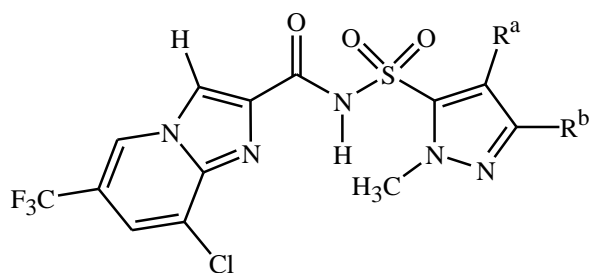


R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	i-Pr	Me	H	i-Pr	Cl	H	i-Pr
H	H	n-Pr	Me	H	n-Pr	Cl	H	n-Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	i-Pr	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr
Br	H	n-Pr	H	Me	n-Pr	Me	Me	n-Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me

Таблица 17b (продовження)

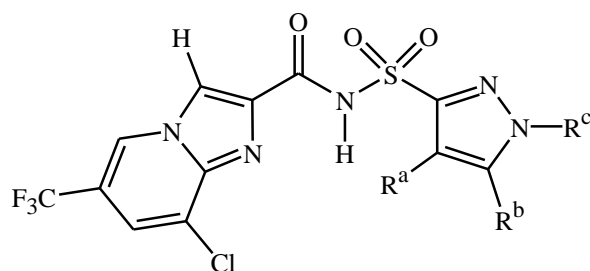
R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	i-Pr	Br	Me	i-Pr	H	Cl	i-Pr
Cl	Me	n-Pr	Br	Me	n-Pr	H	Cl	n-Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr	Cl	Cl	i-Pr	Br	Cl	i-Pr
Me	Cl	n-Pr	Cl	Cl	n-Pr	Br	Cl	n-Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	i-Pr	Me	Br	i-Pr	Cl	Br	i-Pr
H	Br	n-Pr	Me	Br	n-Pr	Cl	Br	n-Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	n-Pr						

Таблица 18



R ^a	R ^b	R ^a	R ^b	R ^a	R ^b	R ^a	R ^b
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	i-Pr	Me	i-Pr	Cl	i-Pr	Br	i-Pr
H	n-Pr	Me	n-Pr	Cl	n-Pr	Br	n-Pr
H	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Br	OMe

Таблица 19

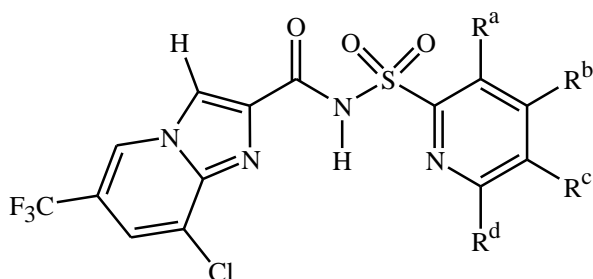


R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	i-Pr	Me	H	i-Pr	Cl	H	i-Pr
H	H	n-Pr	Me	H	n-Pr	Cl	H	n-Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	i-Pr	H	Me	i-Pr	Me	Me	i-Pr

Таблица 19 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
Br	H	n-Pr	H	Me	n-Pr	Me	Me	n-Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	i-Pr	Br	Me	i-Pr	H	Cl	i-Pr
Cl	Me	n-Pr	Br	Me	n-Pr	H	Cl	n-Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	i-Pr	Cl	Cl	i-Pr	Br	Cl	i-Pr
Me	Cl	n-Pr	Cl	Cl	n-Pr	Br	Cl	n-Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	i-Pr	Me	Br	i-Pr	Cl	Br	i-Pr
H	Br	n-Pr	Me	Br	n-Pr	Cl	Br	n-Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	i-Pr						
Br	Br	n-Pr						

Таблица 20

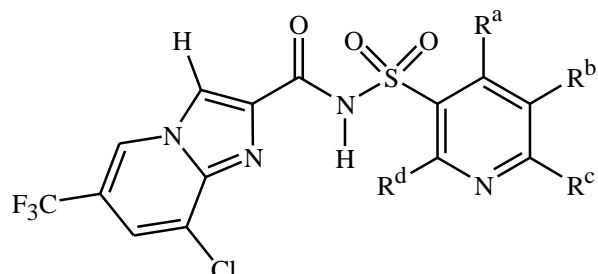


R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
Me	H	H	H	Cl	H	H	H
Me	H	H	Me	Cl	H	H	Me
Me	H	H	OMe	Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H	Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me	Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	OMe	Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H	Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me	Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	OMe	Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H	Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me	Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	OMe	Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H	Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	OMe	Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H	Br	OMe	Me	H
Br	H	H	Me	Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	OMe	Br	OMe	Me	OMe
Br	OMe	H	H	Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me	Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	OMe	Br	Me	H	OMe
Br	H	Me	H	Br	Me	Me	H

Таблица 20 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
Br	H	Me	Me	Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	OMe	Br	Me	Me	OMe

Таблица 21

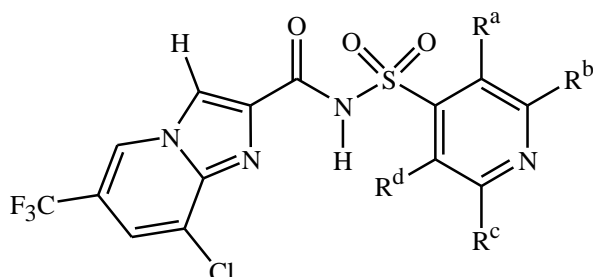


R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃	Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	H	Br	Me	H	H	Br
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br	Me	H	Me	Br
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H
H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H
H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H

Таблиця 21 (продовження)

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me
H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

Таблиця 22



R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

Сполука даного винаходу звичайно буде застосовуватися в якості активного інгредієнта для контролю паразитичної нематоди в композиції, тобто складі, з, щонайменше, одним додатковим компонентом, вибраним із групи, що складеться з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, що є в якості носія. Інгредієнти складу або композиції вибрані відповідно до фізичних властивостей активного інгредієнта, способу внесення та факторів навколишнього середовища, таких як тип ґрунту, вологість і температура.

Застосовні складі включають як рідкі, так і тверді композиції. Рідкі композиції включають розчини (включаючи, концентрати, що емульгуються), суспензії, емульсії (включаючи мікроемульсії і/або суспензії) і подібне, котрі факультативно можуть бути згущені в гелі. Загальними типами водних рідких композицій є розчинний концентрат, суспензійний концентрат, капсульна суспензія, концентрована емульсія, мікроемульсія та суспензійна емульсія. Загальними типами безводних рідких композицій є концентрат, що емульгується, концентрат, що емульгується з утворенням мікроемульсії, концентрат, що диспергується, та масляна дисперсія.

Загальними типами твердих композицій є дусти, порошки, гранули, пелети, пріли, пастилки, таблетки, заповнені плівки (включаючи покриття насіння) і подібне, котрі можуть бути такими, які диспергуються у воді, ("змочувані") або розчинними у воді. Плівки і покриття, утворені з розчинів або текучих суспензій, що утворюють плівку, особливо придатні для обробки насіння. Активний інгредієнт може бути (мікро)інкапсульованим і потім сформованим у суспензію або твердий склад; альтернативно, весь склад активного інгредієнта може бути інкапсульованим (або "покритим"). Інкапсульовання може контролювати або сповільнювати вивільнення активного інгредієнта. Гранула, що емульгується, поєднує переваги як складу концентрату, що емульгується, так і сухого гранулярного складу. Композиції з високою концентрацією, насамперед, використовуються в якості проміжних продуктів для наступних складів.

Склади, що розпилюються, типово розводять в придатному середовищі перед розпиленням. Такі рідкі та тверді складі складені так, щоб легко розбавлялися в середовищі для розпилення, звичайно воді. Об'єми, що розпилюються, можуть варіювати від приблизно одного до кількох тисяч літрів на гектар, але більш типово знаходяться в діапазоні від приблизно десяти до

кількох сотень літрів на гектар. Склади, що розпилюються, можуть бути змішані в баці з водою або іншим придатним середовищем для обробки листя шляхом внесення з літака або наземного внесення або для внесення в ростове середовище рослини. Рідкі і сухіклади можна дозувати безпосередньо в системи краплинного зрошення або дозувати в борозну під час висівання. Рідкі та твердіклади можуть бути нанесені на насіння сільськогосподарських культур і іншу бажану рослинність у вигляді обробок насіння перед висіванням для захисту коренів, що розвиваються, й інших підземних частин рослин і/або листя шляхом системного поглинання.

Склади типово будуть містити ефективні кількості активного інгредієнта, розріджувача та поверхнево-активної речовини в наступних приблизних діапазонах, що складуть в сумі 100 мас. відсотків.

	Активний інгредієнт	Масовий відсоток	
		Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Гранули, таблетки і порошки, що диспергуються у воді та розчинні у воді	0,001–90	0–99,999	0–15
Масляні дисперсії, суспензії, емульсії, розчини (включаючи концентрати, що емульгуються)	1–50	40–99	0–50
Дусти	1–25	70–99	0–5
Гранули та пелети	0,001–95	5–99,999	0–15
Композиції з високою концентрацією	90–99	0–10	0–2

Тверді розріджувачі включають, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, атапульгіт і каолін, гіпс, целюлозу, діоксид титану, оксид цинку, крохмаль, декстрин, цукри (наприклад, лактоза, сахароза), діоксид кремнію, тальк, слюду, діатомову землю, сечовину, карбонат кальцію, карбонат і бікарбонат натрію та сульфат натрію. Типові тверді розріджувачі описані в Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N,N-диметилалканаміди (наприклад, N,N-диметилформамід), лімонен, диметилсульфоксид, N-алкілпіролідони (наприклад, N-метилпіролідинон), етиленгліколь, триетиленгліколь, пропіленгліколь, дипропіленгліколь, поліпропіленгліколь, пропіленкарбонат, бутіленкарбонат, парафіни (наприклад, білі мінеральні масла, нормальні парафіни, ізопарафіни), алкілбензоли, алкілнафталіни, гліцерин, гліцерол-триацетат, сорбіт, триацетин, ароматичні вуглеводні, деароматизовані аліфатичні вуглеводні, алкілбензоли, алкілнафталіни, кетони, такі як циклогексанон, 2-гептанон, ізофорон і 4-гідрокси-4-метил-2-пентанон, ацетати, такі як ізоамілацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонілацетат, тридецилацетат і ізоборнілацетат, інші складні ефіри, такі як алкіловані складні ефіри лактату, двоосновні складні ефіри і γ -бутиролактон, і спирти, що можуть бути лінійними, розгалуженими, насиченими або ненасиченими, такі як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропіловий спирт, н-бутанол, ізобутиловий спирт, н-гексанол, 2-етилгексанол, н-октанол, деканол, ізодециловий спирт, ізооктадеканол, цетиловий спирт, лауриловий спирт, тридециловий спирт, олеїловий спирт, циклогексанол, тетрагідрофурфуріловий спирт, діацетоновий спирт і бензиловий спирт. Рідкі розріджувачі також включають гліцеринові складні ефіри насичених і ненасичених жирних кислот (типово C_6 – C_{22}), такі як рослинні олії насіння та плодів (наприклад, олії з оливи, рицини, насіння льону, кунжуту, кукурудзи (маїсу), арахісу, соняшнику, виноградного насіння, сафлору, насіння бавовнику, сої, насіння рапсу, кокосу і ядра кокосового горіха), тваринні жири (наприклад, яловичий жир, свинячий жир, топлений свинячий жир, жир печінки тріски, риб'ячий жир) і їх суміші. Рідкі розріджувачі також включають алкіловані жирні кислоти (наприклад, метиловані, етиловані, бутиловані), де жирні кислоти можуть бути отримані гідролізом гліцеринових складних ефірів з рослинних і тваринних джерел і можуть бути очищені дистиляцією. Типові рідкі розріджувачі описані в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Тверді та рідкі композиції даного винаходу часто включають одну або більше поверхнево-активних речовин. При додаванні в рідину поверхнево-активні речовини (також відомі як "поверхнево-активні засоби") звичайно модифікують, найчастіше знижують, поверхневий натяг рідини. Залежно від природи гідрофільних і ліпофільних груп у молекулі поверхнево-активної речовини, поверхнево-активні речовини можуть бути придатними в якості змочувальних засобів, диспергаторів, емульгаторів або протиспінюючих засобів.

Поверхнево-активні речовини можуть бути класифіковані як неіонні, аніонні або катіонні. Неіонні поверхнево-активні речовини, придатні для даних композицій, включають, але не обмежуються: спиртові алкоксилати, такі як спиртові алкоксилати на основі природних і синтетичних спиртів (які можуть бути розгалуженими або лінійними) та отримані зі спиртів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей; амінітоксилати, алканоламіди та етоксильовані алканоламіди; алкоксильовані тригліцериди, такі як етоксильована соєва, касторова та рапсова олії; алкілфенолалкоксилати, такі як октилфенолетоксилати, нонілфенолетоксилати, динонілфенолетоксилати та додецилфенолетоксилати (отримані з фенолів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); блок-співполімери, отримані з етиленоксиду або пропіленоксиду, і зворотні блок-співполімери, де кінцеві блоки отримані з пропіленоксиду; етоксильовані жирні кислоти; етоксильовані жирні складні ефіри та масла; етоксильовані метилові складні ефіри; етоксильований тристирилфенол (включаючи отримані з етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); складні ефіри жирних кислот, гліцеринові складні ефіри, похідні на основі ланоліну, поліетиксильовані складні ефіри, такі як поліетиксильовані складні ефіри сорбітану та жирних кислот, поліетиксильовані складні ефіри сорбіту та жирних кислот і поліетиксильовані складні ефіри гліцерину та жирних кислот; інші похідні сорбітану, такі як складні ефіри сорбітану; полімерні поверхнево-активні речовини, такі як статистичні співполімери, блок-співполімери, алкідні пег(поліетиленгліколь) смоли, прищеплені або комбіновані полімери та зіркоподібні полімери; поліетиленгліколі (пег); поліетиленгліколеві складні ефіри жирних кислот; поверхнево-активні речовини на основі силікону; та похідні цукрів, такі як складні ефіри сахарози, алкілполіглікозиди та алкілполісахариди.

Придатні аніонні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються: алкіларилсульфонові кислоти та їх солі; карбоксильований спирт або алкілфенол-етоксилати; дифенілсульфонатні похідні; лігнін і похідні лігніну, такі як лігносульфонати; малеїнову або бурштинову кислоти або їх ангідриди; олефісульфонати; фосфатні складні ефіри, такі як фосфатні складні ефіри спиртових алкоксилатів, фосфатні складні ефіри алкілфенольних алкоксилатів і фосфатні складні ефіри стирилфенольних етоксилатів; поверхнево-активні речовини на основі білка; похідні саркозину; сульфат стирилфенольного ефіру; сульфати та сульфонати масел і жирних кислот; сульфати та сульфонати етоксильованих алкілфенолів; сульфати спиртів; сульфати етоксильованих спиртів; сульфонати амінів і амідів, такі як N,N-алкілтаурати; сульфонати бензолу, кумолу, толуолу, ксилолу та додецил- і тридецилбензолів; сульфонати нафталінів з конденсованими ароматичними кільцями; сульфонати нафталіну та алкілнафталіну; сульфонати фракціонованої нафти; сульфосукцинамат та сульфосукцинати та їх похідні, такі як діалкілсульфосукцинатні солі.

Придатні катіонні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються: амід та етоксильовані аміді; аміни, такі як N-алкілпропандіаміни, трипропілентриаміни та дипропілентетраміни, та етоксильовані аміни, етоксильовані діаміни та пропоксильовані аміни (отримані з амінів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); солі амінів, такі як амінацетати, та солі діамінів; солі четвертинного амонію, такі як четвертинні солі, етоксильовані четвертинні солі та дичетвертинні солі; та аміноксиди, такі як алкілдиметиламіноксиди та біс-(2-гідроксietил)-алкіламіноксиди.

Також придатними для даних композицій є суміші неіонних і аніонних поверхнево-активних речовин або суміші неіонних і катіонних поверхнево-активних речовин. Неіонні, аніонні та катіонні поверхнево-активні речовини та їх рекомендовані застосування розкриті в ряді опублікованих довідкових матеріалів, включаючи McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; і A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиції даного винаходу також можуть містити допоміжні речовини та добавки для складання, відомі фахівцям даної галузі техніки в якості допоміжних засобів для складів (деякі з яких, як можна вважати, функціонують також як тверді розріджувачі, рідкі розріджувачі або поверхнево-активні речовини). Такі допоміжні речовини та добавки для складання можуть контролювати: рН (буфери), спінювання під час обробки (протиспінювачі, такі як поліорганосилоксани), осадження активних інгредієнтів (засоби, що суспендують), в'язкість (тиксотропні загусники), ріст мікробів у контейнері (протимікробні засоби), замерзання продукту (речовини, що знижують температуру замерзання рідини), колір (барвники/пігментні дисперсії), вимивання (плівкоутворювачі або сполучні), випаровування (сповільнювачі випаровування) й інші властивості складу. Плівкоутворювачі включають, наприклад, полівінілацетати,

полівінілацетатні співполімери, полівінілпіролідон-вінілацетатний співполімер, полівінілові спирти, співполімери полівінілового спирту та воски. Приклади допоміжних речовин і добавок складів включають наведені в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; і PCT публікацію WO 03/024222.

Сполука Формули 1 і будь-які інші активні інгредієнти типово включаються в дані композиції шляхом розчинення активного інгредієнта в розчиннику або шляхом диспергування в рідкому або сухому розріджувачі. Розчини, включаючи концентрати, що емульгуються, можуть бути отримані простим змішуванням інгредієнтів. Якщо розчинник рідкої композиції призначений для застосування у вигляді концентрату, що емульгується, не змішується з водою, звичайно додається емульгатор для емульгування розчинника, що містить активний інгредієнт, при розведенні водою. Суспензії активного інгредієнта з діаметрами частинок до 2000 мкм можуть бути подрібнені мокрим розмелом з використанням млинів для розмелу в середовищі з одержанням частинок із середніми діаметрами менше 3 мкм. Водні суспензії можуть бути перетворені в готові суспензійні концентрати (дивись, наприклад, патент США № 3060084) або додатково оброблені за допомогою сушіння розпиленням з утворенням гранул, що диспергуються у воді. Сухі склади звичайно потребують процесів сухого розмелу, що дають середні діаметри частинок у діапазоні від 2 до 10 мкм. Дисти і порошки можна одержати шляхом змішування та звичайно подрібнювання (такого як молотковим млином або струминним млином). Гранули та пелети можна одержати розпиленням активного матеріалу на попередньо гранульовані носії або за допомогою методик агломерації. Дивись Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147–48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pp 8–57 і наступні, і WO 91/13546. Пелети можна одержати, як описано в патенті США № 4172714. Гранули, що диспергуються у воді, та розчинні у воді гранули можна одержати, як обговорюється в патенті США № 4144050, патенті США № 3920442 і патенті Німеччини № 3246493. Таблетки можна одержати, як обговорюється в патенті США № 5180587, патенті США № 5232701 і патенті США № 5208030. Плівки можна одержати, як обговорюється в патенті Великобританії № 2095558 і патенті США № 3299566.

Для додаткової інформації стосовно галузі одержання складів, дивись T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" у Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp 120–133. Дивись також патент США № 3235361, кол. 6, рядок 16 - кол. 7, рядок 19 і Приклади 10–41; патент США № 3309192, кол. 5, рядок 43 - кол. 7, рядок 62 і Приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 і 169–182; патент США № 2891855, кол. 3, рядок 66 - кол. 5, рядок 17 і Приклади 1–4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; і Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

У наступних Прикладах усі склади приготовані традиційними способами. Нумери сполук стосуються сполук у Таблицях Індексів A–D. Без подальшого уточнення вважають, що фахівець у даній галузі за допомогою попереднього опису може використовувати даний винахід в його найповній мірі. Наступні Приклади, отже, повинні розглядатися лише як ілюстративні, а не такі, що обмежують розкриття будь-яким чином. Відсотки є масовими, якщо не зазначене інше.

Приклад А

Концентрат з високою концентрацією

Сполука 7	98,5%
аерогель діоксиду кремнію	0,5%
синтетичний аморфний тонкоподрібнений діоксид кремнію	1,0%

Приклад В

Порошок, що змочується

Сполука 19	65,0%
додецилфеноловий ефір поліетиленгліколю	2,0%
натрію лігнінсульфонат	4,0%
натрію алюмосилікат	6,0%
монтморилоніт (випалений)	23,0%

Приклад С

	Гранула	
	Сполука 30	10,0%
	гранули атапульгіту	
	(низьколетка речовина,	
	0,71/0,30 мм; стандарт США	90,0%
	сита № 25–50)	
	Приклад D	
	Екструдована пелета	
	Сполука 170	25,0%
	безводний натрію сульфат	10,0%
	неочищений кальцію	
	лігнінсульфонат	5,0%
	натрію алкілнафталінсульфонат	1,0%
	кальцію/магнію бентоніт	59,0%
	Приклад E	
5	Концентрат, що емульгується	
	Сполука 179	10,0%
	поліоксіетиленсорбітгексолеат	20,0%
	метиловий складний ефір C ₆ –	
	C ₁₀ жирної кислоти	70,0%
	Приклад F	
	Мікроемульсія	
	Сполука 180	5,0%
	співполімер полівінілпіролідону-	
	вінілацетату	30,0%
	алкілполіглікозид	30,0%
	гліцерилмоноолеат	15,0%
	вода	20,0%
	Приклад G	
	Обробка насіння	
	Сполука 68	20,00%
	співполімер полівінілпіролідону-	
	вінілацетату	5,00%
	монтан-віск (з кислотною	
	групою)	5,00%
	кальцію лігнінсульфонат	1,00%
	блок-співполімери	
	поліоксіетилену/	1,00%
	поліоксипропілену	
	стеариловий спирт (POE 20)	2,00%
	поліорганосилан	0,20%
	червоний барвник	0,05%
	вода	65,75%
10	Приклад H	
	Добриво-паличка	
	Сполука 382	2,50%
	співполімер піролідону та	
	стиролу	4,80%
	тристирилфеніл 16-етоксилат	2,30%
	тальк	0,80%
	кукурудзяний крохмаль	5,00%
	добриво повільного вивільнення	
	Nitrophoska® Permanent 15-9-15	36,00%
	(BASF)	
	каолін	38,00%
	вода	10,60%

Сполуки даного винаходу виявляють активність проти широкого спектра паразитичних шкідників. Ці шкідники включають безхребетних, що заселяють різноманітні навколишні середовища, такі як, наприклад, листя рослини, корені, ґрунт, зібрані сільськогосподарські

культури або інші продукти харчування, будівельні конструкції або зовнішні покриття тварини. Ці шкідники включають, наприклад, безхребетних, що харчуються листям (включаючи листи, стебла, квітки та плоди), насінням, деревиною, текстильними волокнами або кров'ю або тканинами тварини, та, таким чином, спричиняють псування або ушкодження, наприклад, агрономічних сільськогосподарських культур, що вирощуються або зберігаються, лісів, тепличних сільськогосподарських культур, декоративних рослин, саджанці культур, продуктів харчування або волоконних продуктів, що зберігаються, або будинків або інших споруд або їх вмісту, або є шкідливими для здоров'я тварин або здоров'я населення. Фахівці в даній галузі техніки зрозуміють, що не всі сполуки однаково ефективні проти всіх етапів росту всіх шкідників.

Дані сполуки та композиції, таким чином, є придатними агрономічно для захисту польових сільськогосподарських культур від паразитичних нематод, а також неагрономічно для захисту інших садових культур і рослин від рослиноїдних паразитичних нематод. Це застосування включає захист сільськогосподарських культур і інших рослин (тобто як агрономічне, так і неагрономічне), що містять генетичний матеріал, уведений за допомогою генної інженерії (тобто трансгенних), або модифікованих мутагенезом для забезпечення переважних ознак. Приклади таких ознак включають витривалість до гербіцидів, витривалість до рослиноїдних шкідників (наприклад, комах, кліщів, попелиць, рослинні, павуки, нематоди, равлики, фітопатогенні гриби, бактерії та віруси), поліпшений ріст рослин, підвищену витривалість до несприятливих умов вирощування, таких як висока або низька температура, висока або низька вологість ґрунту та висока солоність, збільшене цвітіння або плодоношення, збільшена врожайність, більш швидке дозрівання, більш висока якість і/або поживна цінність продукту зібраного врожаю, або поліпшені властивості зберігання або обробки зібраних продуктів. Трансгенні рослини можна модифікувати для експресії багатьох ознак. Приклади рослин, що містять ознаки, забезпечені генною інженерією або мутагенезом, включають сорти кукурудзи, бавовнику, сої та картоплі, які експресують інсектицидний токсин *Bacillus thuringiensis*, такі як YIELD GARD®, KnockOut®, StarLink®, Bollgard®, NuCOTN® і NewLeaf®, і стійкі до гербіцидів сорти кукурудзи, бавовнику, сої та рапсу, такі як Roundup Ready®, Liberty Link®, IMI®, STS® і Clearfield®, а також зернові, що експресують N-ацетилтрансферазу (GAT) для забезпечення стійкості до гербіциду гліфосату, або зернові, що містять ген HRA, який надає стійкість до гербіцидів, що інгібують ацетолактатсинтазу (ALS). Дані сполуки та композиції можуть синергійно взаємодіяти з ознаками, введеними за допомогою генної інженерії або модифікованими мутагенезом, таким чином, посилюючи фенотипову експресію або ефективність ознак або підвищуючи ефективність контролю паразитичної нематоди даних сполук і композицій. Зокрема, дані сполуки та композиції можуть синергійно взаємодіяти з фенотиповою експресією білків або інших природних продуктів, токсичних для паразитичних нематод, з забезпеченням контролю цих шкідників більшого, ніж адитивний.

Композиції даного винаходу можуть також факультативно містити поживні речовини для рослин, наприклад, композицію добрива, що містить, щонайменше, одну поживну речовину для рослини, вибрану з азоту, фосфору, калію, сірки, кальцію, магнію, заліза, міді, бору, марганцю, цинку та молібдену. Слід зазначити композиції, які містять, щонайменше, одну композицію добрива та містять, щонайменше, одну поживну речовину для рослини, вибрану з азоту, фосфору, калію, сірки, кальцію та магнію. Композиції даного винаходу, що додатково містять, щонайменше, одну поживну речовину для рослини, можуть бути у формі рідин або твердих речовин. Слід зазначити тверді склади у формі гранул, невеликих паличок або таблеток. Тверді склади, що містять композицію добрива, можна одержати змішуванням сполуки або композиції даного винаходу з композицією добрива разом з інгредієнтами, які складають, і потім приготуванням складу за допомогою способів, таких як грануляція або екструзія. Альтернативно, тверді склади можна приготувати розпиленням розчину або суспензії сполуки або композиції даного винаходу в легкому розчиннику на раніше приготовлену композицію добрива у формі стабільних за розміром частинок сумішей, наприклад, гранул, невеликих паличок або таблеток, і потім випарюванням розчинника.

Сполуки даного винаходу можуть виявляти активність проти широкого спектра паразитичних нематод, що живуть або ростуть усередині або харчуються на рослинах (наприклад, листя, плід, стебла, корені або насіння) або тваринах і людях (наприклад, у судинній або травній системах або інших тканинах) і, отже, заподіюють шкоди агрономічним сільськогосподарським культурам, що ростуть і зберігаються, лісівництву, тепличним культурам, декоративним рослинам і саджанцям культур або шкодять здоров'ю тварини та людини. Сільськогосподарськими культурами особливого інтересу є плодові овочі, такі як пасльонові та гарбузові сільськогосподарські культури, плантаційні культури, такі як банан і кава, коренеплоди, такі як картопля, цибуля та морква, та польові культури, такі як тютюн, земляний

горіх, бавовник, цукрова тростина та соя.

Сполуки даного винаходу можуть мати активність до членів обох класів Adenophorea і Secernentea з типу Nematoda, включаючи економічно важливі члени рядів Enoplida, Dorylaimida, Rhabditida, Strongylida, Ascarida, Oxyurida, Spirurida, Tylenchida і Aphelenchida, наприклад, але не обмежуючись, економічно важливі сільськогосподарські шкідники, такі як галові нематоди роду Meloidogyne, цистоутворюючі нематоди роду Heterodera і Globodera, кореневі нематоди роду Pratylenchus, ниркоподібні нематоди роду Rotylenchulus, земляні нематоди роду Radopholus, жалкі нематоди роду Belonolaimus, спіральні нематоди родів Helicotylenchus і Scutellonema, цитрусові нематоди роду Tylenchulus, нематоди, що викликають утворення тупокінцевих коренів, родів Trichodorus і Paratrichodorus, стеблові нематоди роду Xiphinema, нематоди, що зупиняють ріст, роду Tylenchorhynchus, "голчасті" нематоди родів Longidorus і Paralongidorus, нематоди, які мають стилет, роду Hoplolaimus, ектопаразитичні кореневі нематоди родини Criconematidae, стеблові нематоди родів Ditylenchus і Anguina, і листяні/стеблові нематоди родів Aphelenchoides і Rhadinaphelenchus; і паразити тварини і людини (тобто економічно важливі в овелі черви, такі як Strongylus vulgaris у коней, Toxocara canis у собак, Haemonchus contortus в овець, Dirofilaria immitis у собак і т.д.).

Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для контролю південних нематод, що викликають утворення тупокінцевих коренів (Meloidogyne incognita). Фахівці в даній галузі техніки зазначають, що не всі сполуки однаково ефективні для всіх етапів росту всіх нематод.

Сполуки даного винаходу можуть також мати активність до членів типу Platyhelminthes, класів Cestoda (стрічкові черви) і Trematoda (плоскі черви), включаючи паразитів (тобто економічно важливі плоскі черви та стрічкові черви), що заподіюють шкоди здоров'ю тварини та людини (наприклад, Anoplocephala perfoliata у коней, Fasciola hepatica у жуйних тварин і т.д.).

Сполуки даного винаходу можуть бути також змішані з однією або кількома іншими біологічно активними сполуками або засобами, включаючи інсектициди, фунгіциди, нематодциди, бактерициди, акарициди, гербіциди, гербіцидні сафенери, регулятори росту, такі як інгібітори линяння комах і стимулятори укорінення, хімічні стерилізатори, хімічні сигнальні речовини, репеленти, аттрактанти, феромони, стимулятори живлення, інші біологічно активні сполуки або ентомопатогенні бактерії, вірус або гриби, з утворенням багатокомпонентного пестициду, що дає навіть більш широкий спектр агрономічної та неагрономічної корисності. Таким чином, даний винахід також стосується композиції, що містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль і ефективну кількість, щонайменше, однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу та може додатково містити, щонайменше, одне із поверхнево активних речовин, твердих розріджувачів або рідких розріджувачів. Для сумішей даного винаходу інші біологічно активні сполуки або засоби можуть бути складені разом з даними сполуками, включаючи сполуки Формули 1, з утворенням заздалегідь приготованої суміші, або інші біологічно активні сполуки або засоби можуть бути складені окремо від даних сполук, що включають сполуки Формули 1, і два склади об'єднують разом перед внесенням (наприклад, у баці для розпилювання) або, альтернативно, вносять послідовно.

Прикладами таких біологічно активних сполук або засобів, з якими можуть бути складені сполуки даного винаходу, є інсектициди, такі як абамектин, ацефат, ацеквіноцил, ацетаміпрід, акринатрин, амідифлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гама-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діелдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегіпо, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатин оксид, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флувалінат, тау-флувалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксикарб, інсектицидні мила, ізофенфос, луфенурон, малатіон, метафлумізон, метальдегід, метамідфос, метидатіон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, фораат, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетраметрин,

тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, толфенпірад, тралометрин, тріазамат, трихлорфон, трифлумурон, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, ентомопатогенні бактерії, ентомопатогенні віруси та ентомопатогенні гриби.

Слід зазначити інсектициди, такі як абамектин, ацетаміприд, акринатрин, амітраз, авермектин, азадирахтин, біфентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гама-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діелдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флувалінат, форметанат, фостіазат, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, лufenулон, метафлумізон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромесифен, спіротетрамат, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, тріазамат, трифлумурон, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, усі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів ядерного поліедрозу.

Один варіант здійснення біологічних засобів для змішування зі сполуками даного винаходу включає ентомопатогенні бактерії, такі як *Bacillus thuringiensis*, і інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, такі як біоінсектициди MVP® і MVP II®, одержані способом CellCap® (CellCap®, MVP® і MVP II® є торговими марками Mucogen Corporation, Індіанаполіс, Індіана, США); ентомопатогенні гриби, такі як зелений мускардиновий гриб; і ентомопатогенні (як ті, що зустрічаються в природі, так і генетично модифіковані) віруси, включаючи бакуловірус, вірус ядерного поліедрозу (NPV), такий як вірус ядерного поліедрозу *Helicoverpa zea* (HzNPV), вірус ядерного поліедрозу *Anagrapha falcifera* (AfNPV); і вірус гранульозу (GV), такий як вірус гранульозу *Cydia pomonella* (CpGV).

Слід особливо зазначити таку комбінацію, де інший активний інгредієнт для контролю безхребетних шкідників належить до іншого хімічного класу або має інше місце дії, ніж сполука Формули 1. У певних випадках комбінація, щонайменше, з одним іншим активним інгредієнтом для контролю безхребетних шкідників з подібним спектром контролю, але іншим місцем дії, буде особливо переважною для керування стійкістю. Таким чином, композиція даного винаходу може додатково містити, щонайменше, один додатковий активний інгредієнт для контролю безхребетних шкідників з подібним спектром контролю, але який належить до іншого хімічного класу або має інше місце дії. Ці додаткові біологічно активні сполуки або засоби включають, але не обмежуючи, модулятори натрієвого каналу, такі як біфентрин, циперметрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, дельтаметрин, димефлутрин, есфенвалерат, фенвалерат, індоксакарб, метофлутрин, профлутрин, піретрин і тралометрин; інгібітори холінергетичних рецепторів, такі як хлорпірифос, метоміл, оксаміл, тіодикарб і тріазамат; неонікотиніоїди, такі як ацетаміприд, клотіанідин, динотефуран, імідаклоприд, нітенпірам, нітіазин, тіаклоприд і тіаметоксам; інсектицидні макроциклічні лактони, такі як спінеторам, спіносад, абамектин, авермектин і емаектин; антагоністи GABA (γ-аміномасляна кислота)-залежного хлоридного каналу, такі як авермектин, або блокатори, такі як етипрол і фіпроніл; інгібітори синтезу хітину, такі як бупрофезин, циромазин, флуфеноксурон, гексафлумурон, лufenулон, новалурон, новіфлумурон і трифлумурон; імітатори ювенільного гормону, такі як діофенолан, феноксикарб, метопрен і пірипроксифен; ліганди октопамінового рецептора, такі як амітраз; інгібітори линяння та агоністи екдизону, такі як азадирахтин, метоксифенозид і тебуфенозид; ліганди ріанодинового рецептора, такі як ріанодин, антранілові діаміди, такі як хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; аналоги нерейстоксину, такі як картап; інгібітори мітохондріального переносу електронів, такі як хлорфенапір, гідраметилнон і піридабен; інгібітори біосинтезу ліпідів, такі як спіродиклофен і спіромесифен; циклодієнові інсектициди, такі як діелдрин або ендосульфат; піретроїди; карбамати; інсектицидні сечовини; і біологічні засоби, включаючи віруси ядерного поліедрозу (NPV), члени *Bacillus thuringiensis*, інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis* і інші інсектицидні віруси, що зустрічаються в природі або генетично модифіковані.

Додатковими прикладами біологічно активних сполук або засобів, з якими сполуки даного винаходу можуть бути складені, є: фунгіциди, такі як ацибензолар, алдиморф, амисульбром, азокназол, азоксистробін, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб, бентіавалікарб-ізопропіл, біноміал, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бордоська рідина (триосновний сульфат міді), боскалід/нікобіфен, бромукназол, бупіримат, бутіобат, карбоксин, карпропамід, каптафол, каптан, карбендазим, хлорнеб, хлорталоніл, хлосолінат, клотримазол, оксихлорид міді, солі міді,

такі як сульфат міді та гідроксид міді, ціазофамід, цифлунамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дихлофлуанід, диклоцимет, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динокап, дискостробін, дитіанон, додеморф, додин, еконазол, етаконазол, едифенфос, епоксиконазол, етабоксам, етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенкарамід, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпиклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, ферфуразоат, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуметовер, флуопіколід, флуоксастробін, флуквінконазол, флуквінконазол, флузилазол, флусульфамід, флутоланіл, флутріафол, фолпет, фозетил-алюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметалпир, гексаконазол, гімексазол, гуазатин, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, йодикарб, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізоконазол, ізопротіолан, казугаміцин, крезоксим-метил, манкозєб, мандипропамід, манєб, мапаніпірин, мефеноксам, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфокарб, метирам, метоміностробін/феноміностробін, мепаніпірим, метрафенон, міконазол, міклобутаніл, нео-асозин (залізистий метанарсонат), нуаримол, октилінон, офурас, оризастробін, оксадиксил, оксолінова кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, паклобутразол, пенконазол, пенцикурон, пентіопірад, перфуразоат, фосфонова кислота, фталід, пікобензамід, пікоксистробін, поліоксин, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб-гідрохлорид, пропиконазол, пропінеб, прохіназид, протіоконазол, піраклостробін, приазофос, пірифенокс, піриметаніл, пірифенокс, піролнітрин, пірохілон, хінконазол, хіноксифен, хінтозен, силтіофам, симеконазол, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, тебуконазол, текразин, теклофталам, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толіфлуанід, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, тридеморф, триморфамід, трициклазол, трифлуксистробін, трифорин, трітїконазол, уніконазол, валідаміцин, вінклозолін, зинеб, зирам і зоксамід; нематодциди, такі як алдикарб, іміціяфос, оксаміл і фенаміфос; бактеріциди, такі як стрептоміцин; акарициди, такі як амїтраз, хінометїонат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, дієнохлор, етоксазол, феназахін, фенбутатину оксид, фенпропатрин, фенпіроксимат, гекситїазокс, пропаргїт, піридабен і тебуфенпірад.

У певних випадках комбінації сполуки даного винаходу з іншими біологічно активними (зокрема, тими, що використовуються у контролі безхребетних шкідників) сполуками або засобами (тобто активними інгредієнтами) можуть дати більший, ніж адитивний (тобто синергійний) ефект. Зменшення кількості активних інгредієнтів, що вивільняються у навколишнє середовище, і при цьому забезпечення ефективного контролю безхребетних шкідників є завжди бажаним. Якщо виникає синергізм з активними інгредієнтами для контролю безхребетних шкідників при нормах внесення, що дають агрономічно задовільні рівні контролю безхребетних шкідників, такі комбінації можуть бути переважними для зниження витрат у рослинництві та зменшення навантаження на навколишнє середовище.

Сполуки даного винаходу та їх композиції можна застосовувати до рослини, генетично трансформованих для експресії білків, токсичних для безхребетних шкідників (такі як дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*). Такі застосування можуть забезпечити більш широкий спектр захисту рослин і можуть бути переважними для керування стійкістю. Ефект екзогенно внесених сполук даного винаходу може бути синергічним з білками токсину, що експресуються.

Загальні посилання на ці сільськогосподарські протруйники (тобто інсектициди, фунгіциди, нематодциди, акарициди, гербіциди та біологічні засоби) включають *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 і *The BioPesticide Manual*, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для варіантів здійснення, де застосовують один або декілька таких різних учасників змішування, масове співвідношення цих різних учасників змішування (в цілому) до сполуки Формули 1 становить типово від приблизно 1:3000 до приблизно 3000:1. Слід зазначити масові співвідношення від приблизно 1:300 до приблизно 300:1 (наприклад, співвідношення від приблизно 1:30 до приблизно 30:1). Фахівець у даній галузі шляхом нескладного експерименту може легко визначити біологічно ефективні кількості активних інгредієнтів, необхідних для бажаного спектра біологічної активності. Буде очевидно, що включаючи ці додаткові компоненти, можна розширити спектр контрольованих паразитичних нематод, відносно спектра нематод, контрольованих винятково сполукою Формули 1.

У Таблиці А викладені конкретні комбінації сполуки Формули 1 з іншими засобами для контролю безхребетних шкідників, ілюстративними для сумішей, композицій і способів даного винаходу, і вона включає додаткові варіанти здійснення діапазонів масового співвідношення для норм внесення добрив. У першому стовпчику Таблиці А викладено конкретні засоби для

контролю безхребетних (наприклад, “абамектин” у першому рядку). В другому стовпчику Таблиці А представлено спосіб дії (якщо відомий) або хімічний клас засобів для контролю безхребетних шкідників. У третьому стовпчику Таблиці А викладено варіант(варіанти) здійснення діапазонів масових співвідношень для норм, у яких можна вносити засіб для контролю безхребетних шкідників, відносно сполуки Формули 1 (наприклад, “50:1 - 1:50” абамектину відносно сполуки Формули 1 за масою). Таким чином, наприклад, перший рядок Таблиці А, зокрема, розкриває комбінацію сполуки Формули 1 з абамектином, яку можна вносити у масовому співвідношенні від 50:1 до 1:50. Інші рядки Таблиці А потрібно тлумачити подібним чином.

Таблиця А

Засіб контролю безхребетних шкідників	Спосіб дії або хімічний клас	Типове масове співвідношення
Абамектин	макроциклічні лактони	50:1 - 1:50
Ацетаміприд	неонікотиноїди	150:1 - 1:200
Амітраз	ліганди октопамінового рецептора	200:1 - 1:100
Авермектин	макроциклічні лактони	50:1 - 1:50
Азадирахтин	агоністи екдизону	100:1 - 1:120
Бета-цифлутрин	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Біфентрин	модулятори натрієвого каналу	100:1 to 1:10
Бупрофезин	інгібітори синтезу хітину	500:1 - 1:50
Картап	аналоги нерестоксину	100:1 - 1:200
Хлорантраніліпрол	ліганди ріанодинового рецептора	100:1 - 1:120
Хлорфенапір	інгібітори мітохондріального переносу електронів	300:1 - 1:200
Хлорпірифос	інгібітори холінестерази	500:1 - 1:200
Клотіанідин	неонікотиноїди	100:1 - 1:400
Ціантраніліпрол	ліганди ріанодинового рецептора	100:1 - 1:120
Цифлутрин	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Цигалотрин	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Циперметрин	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Циромазин	інгібітори синтезу хітина	400:1 - 1:50
Дельтаметрин	модулятори натрієвого каналу	50:1 - 1:400
Діелдрин	циклодієнові інсектициди	200:1 - 1:100
Динотефуран	неонікотиноїди	150:1 - 1:200
Діюфенолан	інгібітор линяння	150:1 - 1:200
Емаектин	макроциклічні лактони	50:1 - 1:10
Ендосульфат	циклодієнові інсектициди	200:1 - 1:100
Есфенвалерат	модулятори натрієвого каналу	100:1 - 1:400
Етипрол	блокатори GABA-регульованого хлоридного каналу	200:1 - 1:100
Фенотіокарб		150:1 - 1:200
Феноксикарб	імітатори ювенільного гормону	500:1 - 1:100
Фенвалерат	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Фіпроніл	блокатори GABA-регульованого хлоридного каналу	150:1 - 1:100
Флонікамід		200:1 - 1:100
Флубендіамід	ліганди ріанодинового рецептора	100:1 - 1:120
Флуфеноксурон	інгібітори синтезу хітину	200:1 - 1:100
Гексафлумурон	інгібітори синтезу хітину	300:1 - 1:50
Гідраметилнон	інгібітори мітохондріального переносу електронів	150:1 - 1:250
Імідаклоприд	неонікотиноїди	1000:1 - 1:1000
Індоксикарб	модулятори натрієвого каналу	200:1 - 1:50
Лямбда-цигалотрин	модулятори натрієвого каналу	50:1 - 1:250
Луфенурон	інгібітори синтезу хітину	500:1 - 1:250
Метафлумізон		200:1 - 1:200
Метоміл	інгібітори холінестерази	500:1 - 1:100

Таблиця А (продовження)

Засіб контролю безхребетних шкідників	Спосіб дії або хімічний клас	Типове масове співвідношення
Метопрен	імітатори ювенільного гормону	500:1 - 1:100
Метоксифенозид	агоністи екдизону	50:1 - 1:50
Нітенпірам	неонікотиніоїди	150:1 - 1:200
Нітіазин	неонікотиніоїди	150:1 - 1:200
Новалурон	інгібітори синтезу хітину	500:1 - 1:150
Оксаміл	інгібітори холінестерази	200:1 - 1:200
Піметрозин		200:1 - 1:100
Піретрин	модулятори натрієвого каналу	100:1 - 1:10
Піридабен	інгібітори мітохондріального переносу електронів	200:1 - 1:100
Піридаліл		200:1 - 1:100
Пірипроксифен	імітатори ювенільного гормону	500:1 - 1:100
Ріанодин	ліганди ріанодинового рецептора	100:1 - 1:120
Спінеторам	макроциклічні лактони	150:1 - 1:100
Спіносад	макроциклічні лактони	500:1 - 1:10
Спіродиклофен	інгібітори біосинтезу ліпідів	200:1 - 1:200
Спіромезифен	інгібітори біосинтезу ліпідів	200:1 - 1:200
Тебуфенозид	агоністи екдизону	500:1 - 1:250
Тіаклоприд	неонікотиніоїди	100:1 - 1:200
Тіаметоксам	неонікотиніоїди	1250:1 - 1:1000
Тіодикарб	інгібітори холінестерази	500:1 - 1:400
Тіосултап-натрій		150:1 - 1:100
Тралометрин	модулятори натрієвого каналу	150:1 - 1:200
Триамаат	інгібітори холінестерази	250:1 - 1:100
Трифлумурон	інгібітори синтезу хітину	200:1 - 1:100
Bacillus thuringiensis	біологічні засоби	50:1 - 1:10
Дельта-ендотоксин Bacillus thuringiensis	біологічні засоби	50:1 - 1:10
NPV (наприклад, Gemstar)	біологічні засоби	50:1 - 1:10

Слід зазначити композицію даного винаходу, де, щонайменше, одна додаткова біологічно активна сполука або засіб вибраний із засобів для контролю безхребетних шкідників, викладених у Таблиці А вище.

Масові співвідношення сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі до додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників типово становлять від 1000:1 до 1:1000, відповідно до одного варіанта здійснення – від 500:1 до 1:500, відповідно до іншого варіанта здійснення – від 250:1 до 1:200 і відповідно до іншого варіанта здійснення – від 100:1 до 1:50.

Викладене нижче в Таблицях В1 - В14 є варіантами здійснення конкретних композицій, що містять сполуку Формули 1 (номери сполук (№ спол.) стосуються сполук у Таблицях Індексів А–D) і додатковий засіб для контролю безхребетних шкідників.

Таблиця В1

№ суміші	№ спол.	Засіб контролю безхребетних шкідників	№ суміші	№ спол.	Засіб контролю безхребетних шкідників
B1-1	7	і Абамектин	B1-36	7	і Імідаклоприд
B1-2	7	і Ацетаміприд	B1-37	7	і Індоксакарб
B1-3	7	і Амїтраз	B1-38	7	і Лямбда-цигалотрин
B1-4	7	і Авермектин	B1-39	7	і Луфенурон
B1-5	7	і Азадирахтин	B1-40	7	і Метафлумізон
B1-5a	7	і Бенсултап	B1-41	7	і Метоміл
B1-6	7	і Бета-цифлутрин	B1-42	7	і Метопрен
B1-7	7	і Біфентрин	B1-43	7	і Метоксифенозид

Таблиця В1 (продовження)

№ суміші	№ спол.	і	Засіб контролю безхребетних шкідників	№ суміші	№ спол.	і	Засіб контролю безхребетних шкідників
B1-8	7	і	Бупрофезин	B1-44	7	і	Нітенпірам
B1-9	7	і	Картап	B1-45	7	і	Нітіазин
B1-10	7	і	Хлорантраніліпрол	B1-46	7	і	Новалурон
B1-11	7	і	Хлорфенапір	B1-47	7	і	Оксаміл
B1-12	7	і	Хлорпірифос	B1-48	7	і	Фосмет
B1-13	7	і	Клотіанідин	B1-49	7	і	Піметрозин
B1-14	7	і	Ціантраніліпрол	B1-50	7	і	Піретрин
B1-15	7	і	Цифлутрин	B1-51	7	і	Піридабен
B1-16	7	і	Цигалотрин	B1-52	7	і	Піридаліл
B1-17	7	і	Циперметрин	B1-53	7	і	Пірипроксифен
B1-18	7	і	Циромазин	B1-54	7	і	Ріанодин
B1-19	7	і	Дельтаметрин	B1-55	7	і	Спінеторам
B1-20	7	і	Діелдрин	B1-56	7	і	Спіносад
B1-21	7	і	Динотефуран	B1-57	7	і	Спіродиклофен
B1-22	7	і	Діюфенолан	B1-58	7	і	Спіромезифен
B1-23	7	і	Емаектин	B1-59	7	і	Спіротетрамат
B1-24	7	і	Ендосульфат	B1-60	7	і	Тебуфенозид
B1-25	7	і	Есфенвалерат	B1-61	7	і	Тіаклоприд
B1-26	7	і	Етипрол	B1-62	7	і	Тіаметоксам
B1-27	7	і	Фенотіокарб	B1-63	7	і	Тіодикарб
B1-28	7	і	Феноксикарб	B1-64	7	і	Тіосултап-натрій
B1-29	7	і	Фенвалерат	B1-65	7	і	Толфенпірад
B1-30	7	і	Фіпроніл	B1-66	7	і	Тралометрин
B1-31	7	і	Флонікамід	B1-67	7	і	Триазамат
B1-32	7	і	Флубендіамід	B1-68	7	і	Трифлумурон
B1-33	7	і	Флуфеноксурон	B1-69	7	і	Bacillus thuringiensis
B1-34	7	і	Гексафлумурон	B1-70	7	і	дельта-ендотоксин Bacillus thuringiensis
B1-35	7	і	Гідраметилнон	B1-71	7	і	NPV (наприклад, Gemstar)

Таблиця В2

- 5 Таблиця В2 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 19. Наприклад, перша суміш у Таблиці В2 позначена В2-1 і являє собою суміш сполуки 19 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В3

- 10 Таблиця В3 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 30. Наприклад, перша суміш у Таблиці В3 позначена В3-1 і являє собою суміш сполуки 30 додаткового засобу абамектин для контролю безхребетних шкідників.

Таблиця В4

- 15 Таблиця В4 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 68. Наприклад, перша суміш у Таблиці В4 позначена В4-1 і являє собою суміш сполуки 20 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В5

- 20 Таблиця В5 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 170. Наприклад, перша суміш у Таблиці В5 позначена В5-1 і являє собою суміш сполуки 170 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В6

- 25 Таблиця В6 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 179. Наприклад, перша суміш у

Таблиці В6 позначена В6-1 і являє собою суміш сполуки 179 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В7

5 Таблиця В7 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 180. Наприклад, перша суміш у Таблиці В7 позначена В7-1 і являє собою суміш сполуки 180 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В8

10 Таблиця В8 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 356. Наприклад, перша суміш у Таблиці В8 позначена В8-1 і являє собою суміш сполуки 356 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В9

15 Таблиця В9 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 357. Наприклад, перша суміш у Таблиці В9 позначена В9-1 і являє собою суміш сполуки 357 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В10

20 Таблиця В10 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 382. Наприклад, перша суміш у Таблиці В10 позначена В10-1 і являє собою суміш сполуки 382 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В11

25 Таблиця В11 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 413. Наприклад, перша суміш у Таблиці В11 позначена В11-1 і являє собою суміш сполуки 413 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В12

30 Таблиця В12 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 465. Наприклад, перша суміш у Таблиці В12 позначена В12-1 і являє собою суміш сполуки 465 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В13

35 Таблиця В13 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 474. Наприклад, перша суміш у Таблиці В13 позначена В13-1 і являє собою суміш сполуки 474 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Таблиця В14

40 Таблиця В14 ідентична Таблиці В1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 394. Наприклад, перша суміш у Таблиці В14 позначена В14-1 і являє собою суміш сполуки 394 і додаткового засобу для контролю безхребетних шкідників абамектину.

Конкретні суміші, викладені в Таблицях В1 - В14, типово об'єднують сполуку Формули 1 з іншим засобом проти безхребетних шкідників у співвідношеннях, визначених у Таблиці А.

45 Викладене нижче в Таблицях С1 - С14 є варіантами здійснення конкретних композицій, що містять сполуку Формули 1 (номери сполук (№ спол.) стосуються сполук у Таблицях Індексів А–D) і додатковий фунгіцид.

Таблиця С1

№ суміші	№ спол.	і	Фунгіцид	№ суміші	№ спол.	і	Фунгіцид
С1-1	7	і	Пробеназол	С1-17	7	і	Дифенокназол
С1-2	7	і	Тіадиніл	С1-18	7	і	Ципроконазол
С1-3	7	і	Ізотіаніл	С1-19	7	і	Пропіконазол
С1-4	7	і	Пірохілон	С1-20	7	і	Феноксаніл
С1-5	7	і	Метоміностробін	С1-21	7	і	Феримзон
С1-6	7	і	Флутоланіл	С1-22	7	і	Фталід
С1-7	7	і	Валідаміцин	С1-23	7	і	Казугаміцин
С1-8	7	і	Фураметпір	С1-24	7	і	Пікоксистробін
С1-9	7	і	Пенцикурон	С1-25	7	і	Пентіопірад

Таблиця С1 (продовження)

№ суміші	№ спол.	і	Фунгіцид	№ суміші	№ спол.	і	Фунгіцид
C1-10	7	і	Симеконазол	C1-26	7	і	Фамоксадон
C1-11	7	і	Оризастробін	C1-27	7	і	Цимоксаніл
C1-12	7	і	Трифлуксисстробін	C1-28	7	і	Прохіназид
C1-13	7	і	Ізопротіолан	C1-29	7	і	Флузілазол
C1-14	7	і	Азоксистробін	C1-30	7	і	Манкозєб
C1-15	7	і	Трициклазол	C1-31	7	і	Гідроксид міді
C1-16	7	і	Гексаконазол	C1-32	7	і	(а)

(а) 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-3-ізоксазоліл]-2-тіазоліл]-1-піперидиніл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон

5 Таблиця С2

Таблиця С2 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 19. Наприклад, перша суміш у Таблиці С2 позначена С2-1 і являє собою суміш сполуки 19 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

10 Таблиця С3

Таблиця С3 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 30. Наприклад, перша суміш у Таблиці С3 позначена С3-1 і являє собою суміш сполуки 30 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

15 Таблиця С4

Таблиця С4 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 68. Наприклад, перша суміш у Таблиці С4 позначена С4-1 і являє собою суміш сполуки 68 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

20 Таблиця С5

Таблиця С5 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 170. Наприклад, перша суміш у Таблиці С5 позначена С5-1 і являє собою суміш сполуки 170 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

25 Таблиця С6

Таблиця С6 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 179. Наприклад, перша суміш у Таблиці С6 позначена С6-1 і являє собою суміш сполуки 179 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

30 Таблиця С7

Таблиця С7 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 180. Наприклад, перша суміш у Таблиці С7 позначена С7-1 і являє собою суміш сполуки 180 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

35 Таблиця С8

Таблиця С8 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 356. Наприклад, перша суміш у Таблиці С8 позначена С8-1 і являє собою суміш сполуки 356 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

40 Таблиця С9

Таблиця С9 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 357. Наприклад, перша суміш у Таблиці С9 позначена С9-1 і являє собою суміш сполуки 357 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

45 Таблиця С10

Таблиця С10 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою "№ спол." замінено посиланням на сполуку 382. Наприклад, перша суміш у Таблиці С10 позначена С10-1 і являє собою суміш сполуки 382 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

50

Таблиця С11

Таблиця С11 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 413. Наприклад, перша суміш у Таблиці С11 позначена С11-1 і являє собою суміш сполуки 413 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

Таблиця С12

Таблиця С12 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 465. Наприклад, перша суміш у Таблиці С12 позначена С12-1 і являє собою суміш сполуки 465 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

Таблиця С13

Таблиця С13 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 474. Наприклад, перша суміш у Таблиці С13 позначена С13-1 і являє собою суміш сполуки 474 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

Таблиця С14

Таблиця С14 ідентична Таблиці С1 за винятком того, що кожне посилання на сполуку 7 у стовпчику під назвою “№ спол.” замінено посиланням на сполуку 394. Наприклад, перша суміш у Таблиці С14 позначена С14-1 і являє собою суміш сполуки 394 і додаткового фунгіциду пробеназолу.

Паразитичні нематоди контролюють у агрономічних і неагрономічних застосуваннях шляхом внесення однієї або декількох сполук даного винаходу, типово у формі композиції, у біологічно ефективній кількості в навколишнє середовище шкідників, включаючи агрономічне та/або неагрономічне місце зараження, на область, яку треба захистити, або безпосередньо на шкідників, яких треба контролювати.

Таким чином, даний винахід включає спосіб контролю паразитичної нематоди в агрономічних і/або неагрономічних застосуваннях, що включає контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю однієї або декількох сполук даного винаходу або з композицією, що містить, щонайменше, одну таку сполуку або композицію, яка містить, щонайменше, одну таку сполуку та, щонайменше, одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб. Приклади придатних композицій, що містять сполуку даного винаходу та, щонайменше, одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб, включають гранулярні композиції, де додаткова активна сполука присутня в тій же гранулі, що і сполука даного винаходу, або в гранулах, окремо від гранул сполуки даного винаходу.

Для досягнення контакту з сполукою або композицією даного винаходу для захисту польових культур від паразитичних нематод сполуку або композицію типово наносять на насіння сільськогосподарської культури перед сіянням, на листяну частину (наприклад, листя, стебла, квітки, плоди) сільськогосподарських рослин, або вносять в ґрунт або інше ростове середовище до або після висівання сільськогосподарської культури.

Одним варіантом здійснення способу контакту є розпилення. Альтернативно, гранулярну композицію, що містить сполуку за даним винаходом, можна наносити на листову частину рослини або вносити в ґрунт. Сполуки за даним винаходом можуть бути також ефективно доставлені шляхом поглинання рослиною за допомогою контакту рослини з композицією, що містить сполуку даного винаходу, внесеною у вигляді просочення ґрунту рідким складом, гранулярного складу у ґрунт, обробки ящика для садженців або занурення рослин, які висаджують. Слід зазначити композицію даного винаходу у формі рідкого складу для просочення ґрунту. Також слід зазначити спосіб контролю паразитичної нематоди, що включає контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки даного винаходу або з композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки даного винаходу. Крім того, слід зазначити даний спосіб, де навколишнім середовищем є ґрунт, і композицію вносять у ґрунт у вигляді складу для просочення ґрунту. Додатково слід зазначити, що сполуки даного винаходу також ефективні при локальному нанесенні на місце зараження. Інші способи контакту включають внесення сполуки або композиції даного винаходу за допомогою розчинів, що розпилюються, безпосередньої дії та з післядією, розчинів для розпилення з літака, гелів, покриттів для насіння, мікрокапсуляції, системного поглинання, принад, вушних бирик, болюсів, аерозольних генераторів, фумігантів, аерозолів, дустів і багатьох інших. Один варіант здійснення способу контакту включає стабільну за розміром гранулу добрива, паличку або таблетку, що містить сполуку або композицію даного винаходу. Сполуки даного винаходу можуть також бути просочені в матеріали для виготовлення пристроїв для контролю безхребетних (наприклад, сіток від комах).

Сполуки даного винаходу також застосовні при обробках насіння для захисту насіння від паразитичних нематод. У контексті даного опису та формули винаходу обробка насіння означає контакт насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки даного винаходу, що типово складена у вигляді композиції даного винаходу. Ця обробка насіння захищає насіння від безхребетних ґрунтових шкідників і звичайно може також захищати корені та інші частини рослини, які контактують з ґрунтом, розсади, що розвивається з насіння, яке проростає. Обробка насіння може також забезпечувати захист листової частини шляхом пересування у рослині сполуки даного винаходу або другого активного інгредієнта впродовж розвитку рослини. Обробки насіння можна застосовувати до всіх типів насіння, включаючи такі, з яких будуть проростати рослини, генетично трансформовані для експресії спеціалізованих ознак. Ілюстративні приклади генетично трансформованих рослин включають такі, котрі експресують білки, токсичні для паразитичних нематод, такі як токсин *Bacillus thuringiensis*, або такі, котрі експресують стійкість до гербіциду, такі як гліфосатацетилтрансфераза, яка забезпечує стійкість до гліфосату.

Один спосіб обробки насіння являє собою розпилення або обпилювання насіння сполукою даного винаходу (тобто у вигляді складеної композиції) перед висіванням насіння. Композиції, складені для обробки насіння, звичайно містять плівкоутворювач або адгезивний засіб. Отже, зазвичай, композиція для покриття насіння даного винаходу містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі та плівкоутворювач або адгезивний засіб. Насіння може бути покрите шляхом розпилення рідкого суспензійного концентрату безпосередньо на шар насіння в барабані, що обертається, та потім сушіння насіння. Альтернативно, на насіння можна розпилювати інші типи складів, такі як змочувані порошки, розчини, суспензії, концентрати, що емульгуються, та емульсії у воді. Цей спосіб є особливо застосовним для нанесення плівкових покриттів на насіння. Різні машини та способи для нанесення покриттів доступні фахівцям в даній галузі техніки. Придатні способи включають викладені в P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57, і наведених там посиланнях.

Оброблене насіння типово містить сполуку даного винаходу в кількості від приблизно 0,1 г до 1 кг на 100 кг насіння (тобто від приблизно 0,0001 до 1% за масою насіння перед обробкою). Рідка суспензія, складена для обробки насіння, типово містить від приблизно 0,5 до приблизно 70% активного інгредієнта, від приблизно 0,5 до приблизно 30% плівкоутворюючого адгезива, від приблизно 0,5 до приблизно 20% диспергуючого засобу, від 0 до приблизно 5% загусника, від 0 до приблизно 5% пігменту та/або барвника, від 0 до приблизно 2% протиспінюючого засобу, від 0 до приблизно 1 % консерванту та від 0 до приблизно 75% леткого рідкого розріджувача.

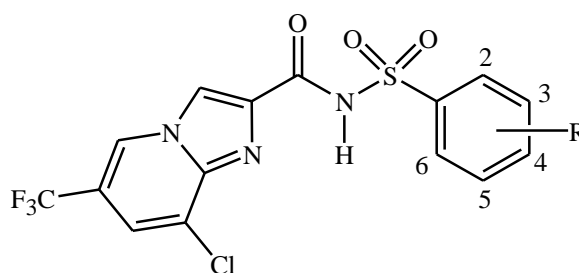
Для агрономічних застосувань норма внесення, необхідна для ефективного контролю, (тобто "біологічно ефективна кількість") буде залежати від таких факторів, як вид нематоди, яку треба контролювати, життєвий цикл нематоди, стадія життя, її розмір, місце розташування, пора року, культура або тварина-хазяїн, харчова поведінка, поведінка при паруванні, навколишня вологість, температура та подібне. За нормальних обставин норми внесення від приблизно 0,01 до 2 кг активних інгредієнтів на гектар є достатніми для контролю нематод в агрономічних екосистемах, але може бути достатньо, щонайменше, 0,0001 кг/гектар або може бути потрібно до 8 кг/гектар. Для неагрономічних застосувань ефективні робочі витрати будуть у діапазоні від приблизно 1,0 до 50 мг/квадратний метр, але може бути достатньо, щонайменше, 0,1 мг/квадратний метр або може бути потрібно до 150 мг/квадратний метр. Фахівець у даній галузі може легко визначити біологічно ефективну кількість, необхідну для бажаного рівня контролю паразитичної нематоди.

Сполуки за даним винаходом, одержані способами, описаними в даному документі, показані в Таблицях Індексів А–Е. Для мас-спектрометричних даних числове значення, повідомлене в стовпчику "AP⁺ (M+1)", є молекулярною масою молекулярного іона, який спостерігають, утвореного додаванням H⁺ (молекулярна маса 1) до молекули, що має найбільшу ізотопну поширеність (тобто M); числове значення, повідомлене в стовпчику "AP⁻ (M-1)", являє собою молекулярну масу молекулярного іона, який спостерігають, утвореного при втраті H⁺ (молекулярна маса 1) молекулою, що має найбільшу ізотопну поширеність (тобто M). Про присутність молекулярних іонів, що містять один або більше ізотопів з більш високою атомною масою і меншою поширеністю (наприклад, ³⁷Cl, ⁸¹Br), не повідомляється. Повідомлені піки M+1 і M-1 спостерігали за допомогою мас-спектрометрії з застосуванням хімічної іонізації при атмосферному тиску (AP⁺).

У Таблицях Індексів застосовані наступні аббревіатури: Спол. означає Сполука. Змінні "R" і "(R¹)_n" являють собою один або комбінацію замісників, які викладені в Таблицях Індексів.

Абревіатура "Прикл." означає "Приклад" і супроводжується цифрою, що вказує в якому прикладі синтезу отримано сполуку.

Таблиця індексів А



Спол.	R **	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
1	2-метокси, 5-хлор	248-250		
2	2-метокси, 5-метил	250		
3	2-метокси, 5-ціано	250		
4	2-дифторметил, 5-фтор	231-232		
5	2-метокси, 5-трифторметил	250		
6	2-дифторметил, 5-метокси	196-197		
7 (Прикл. 1)	2-хлор, 5-метокси	211-212		
8	2-дифторметокси, 5-метил	216-217		
9	2-дифторметил, 5-хлор	229-230		
10	2-хлор, 5-ціано	250		
11	2-метил, 5-бром	216-217		
12	2-метил, 5-CO ₂ CH ₃	206-207		
13	2-метил, 5-ізопропіл	226-227		
14	2-метокси, 5-CO ₂ CH ₃	>250		
15	2-метил, 5-S(O) ₂ CH ₃	248-249		
16	2-SCH ₂ CH ₃ , 5-хлор	229-230		
17	2-нітро, 5-хлор	>250		
18	2-SCH ₃ , 5-хлор	>250		
19	2-хлор, 5-C(O)CH ₃	244-245		
20	2-трифторметил, 5-хлор	219-220		
21	2-SCH ₃ , 5-метокси	236-237		
22	2-хлор, 5-OCH ₂ Ph	>250		
23	2-хлор-5-S(O) ₂ CH ₃	241-242		
24	2,4-дихлор, 5-CO ₂ CH ₃	164-165		
25	2-хлор, 4-ціано	224-225		
26	2-йод	243-244		
27	2-йод, 4-трифторметил	229-230		
28	2-хлор, 5-CO ₂ CH ₃	245-246		
29	2,4,6-трифтор	222-223		
30 (Прикл. 2)	2,5-диметил, 4-ціано	228-229		
31	2-дифторметил	193-194		
32	2-метил, 3-хлор	196-197		
33	4-CO ₂ CH ₃	243-244		
34	2-NHC(O)CH ₃	242-243		
35	2-SCH ₃ , 3-хлор	200-201		
36	2-метил, 6-дифторметокси	237-238		
37	2-дифторметокси, 4-метил	182-183		

Таблиця індексів А (продовження)

Спол.	R **	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
38	2-метил, 4-дифторметокси	197-198		
39	3-хлор, 4-нітро	198-199		
40	3-нітро, 4-хлор	196-197		
41	2-хлор, 6-CH ₂ OCH ₃	207-208		
42	4-S(O) ₂ CH ₃	>250		
43	2-(2-піридиніл)	>250		
44	2-феніл	251-252		
45	3-нітро, 4-метокси	245-246		
46	2-метокси, 3-пропіл	168-169		
47	2-OC(CH ₃) ₃	208-209		
48	2-CO ₂ CH ₃ , 4-метил	>250		
49	2-CH ₂ CO ₂ CH ₃	162-163		
50	2-(2-(1,3,4-оксадіазиніл))	>250		
51	2-(1-(1,3,4-триазиніл))	>250		
52	2-(5-ізоксазоліл)	>250		
53	2-(2-оксазоліл)	>250		
54	2-(4-ізоксазоліл)	231-232		
55	2-(1-імідазоліл)	157-158		
56	2-(1-піразоліл)	>250		
57	2-ціано, 3-хлор	215-216		
58	2-нітро, 3-метил	241-242		
59	2-нітро, 5-метил	249-250		
60	2-(CH(CH ₃)OCH ₃)	224-225		
61	2-етокси, 3-метил	157-158		
62	2-метокси, 3-хлор	191-192		
63	2,5-диметил, 4-хлор	213-214		
64	2-фтор, 6-CH ₂ OCH ₃	182-183		
65	2-ізопропіл, 4-ціано, 5-метил	216-217		
66	2,5-диметил, 4-бром	224-225		
67	2,5-диметил, 4-ізопропіл	193-194		
68	2-нітро, 5-метокси	233-234		
69	3-метил, 4-ціано	231-232		
70	2,5-діізопропіл, 4-ціано	209-210		
71	2,5-діетил, 4-ціано	237-238		
72	2,5-дипропіл, 4-ціано	181-182		
73	2,5-діетил, 4-фтор	187-188		
74	2,5-діізопропіл, 4-нітро	198-199		
75	2,5-діізопропіл, 4-метокси	141-142		
76	2,6-диметил	>250		
77	3-ізопропіл, 4-метокси	182-183		
78	2,5-діізопропіл, 4-метил	185-186		
79	2-ціано, 3-фтор	227-228		
80	2-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂ , 3-метокси	157-158		
81	2-етил	190-191		
82	3-хлор, 4-метокси	204-205		
83	2,3-диметил, 5-нітро	>250		
85	2-ізопропіл	190-191		
86	2-метил	193-194		
87	2-йод	149-150		

Таблиця індексів А (продовження)

Спол.	R **	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
88	2-S(O)CH ₃ , 5-метокси	147-149		
89	2-фтор, 4,5-диметокси	159-160		
90	2-метил, 4,5-диметокси	196-197		
91	2,3,4,5-тетраметил	>250		
92	2,3,4,6-тетраметил	220-221		
93	2,4,5-триметил	208-209		
94	-		404	402
95	4-метокси			432
96	4-метил		418	416
97	4-хлор		438	436
98	3-хлор		438	436
99	4-ціано			427
100	3,5-дихлор		472	470
101	2,5-дихлор			470
102	2-метил, 4-фтор	245-250		
103	2-метил, 5-фтор		436	434
104	2-трифторметил		472	470
105	2-бром		482	
106	3,4-дихлор		472	470
107	2,4-дихлор		472	470
108	2-фтор	*		
109	2-метил		418	416
110	2,3,4-трихлор			504
111	2-метил, 5-хлор		452	450
112	2-хлор, 5-нітро		483	
113	2,4,5-трихлор			504
114	2,3-дихлор		472	470
115	2-метокси		434	432
116	2-метил, 5-нітро		463	461
117	2,6-дифтор		440	438
118	2-циклопропіл		444	442
119	2-трифторметокси		488	486
120	2,4,6-триметил			444
121	2-ціано		429	427
122	2-CO ₂ CH ₃		462	460
123	2-нітро		449	
124	2-S(O) ₂ CH ₃		482	480
125	OCH ₂ C≡CH		458	456
126	2-трифторметокси, 4-бром		566	564
127	2,5-диметокси		464	462
128	2-SCH ₂ CH ₂ CH ₃			476
129	2,3,4,5,6-пентафтор		494	492
130	2-хлор, 4-метил		452	450
131	2,4-дифтор		440	438
132	2,5-дифтор		440	438
133	2-фтор, 5-хлор		456	454
134	3-фтор		422	420
135	3,5-дифтор		440	438
136	2-фтор, 4-хлор		456	454

Таблиця індексів А (продовження)

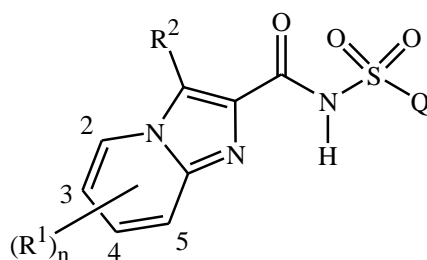
Спол.	R **	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
137	2-фтор, 5-метил	204-205		
138	2-хлор, 4-трифторметил		506	504
139	2,5-диметил		432	430
140	3-метокси	*		
141	3-нітро		449	447
142	2-(1-метилтетразоліл)		486	484
143	2-фтор, 5-трифторметил		490	488
144	3-ціано		429	427
145	3-трифторметил		472	470
146	3-бром		482	480
147	2,6-дихлор, 4-трифторметил		542	540
148	3-аміно			417
149	2-бром, 4-фтор		502	500
150	2-бром, 4-трифторметил		550	
151	2-метил, 5-дифторметокси	225-226		
319	2-бром, 5-трифторметил	*		
329	2-метил, 5-трифторметил	257-258		
330	2,4-дихлор, 5-метил	234-235		
331	2-метил, 4-бром, 5-метокси	228-229		
332	2-метил, 4-ціано, 5-метокси	160-162		
333	2-метил, 4,5-дихлор	160-161		
334	2-ацетил	222-223		
335	4-нітро	>250		
336	2-йод, 4-метокси	204-205		
337	2-трифторметокси, 5-хлор	212-213		
338	2-диметиламіно, 5-нітро	220-221		
339	3,5-дикарбометокси	231-232		
340	3,5-ди(трифторметил)	>250		
341	2,5-дибром, 4-ізопропіл	143-144		
342	2-метил, 4-бром	207-208		
343	2-метил, 5-метокси	206-207		
344	2,5-дифтор, 4-бром	208-209		
345	2-нітро, 4-ізопропіл, 5-бром	210-211		
346	2,6-дибром, 4-метил	198-199		
347	2-метил, 4-хлор	209-210		
348	3-диметиламіно	126-127		
349	4-фтор	242-243		
350	4-(CF ₂ CF ₂ H)	194-195		
351	2-йод, 3-нітро	246-247		
352	2-фтор, 3-хлор	239-240		
353	2-бром, 3-метил	206-207		
354	2,5-дикарбометокси	234-235		
355	2,5-діетил, 4-бром	184-185		
356	2-хлор, 5-метил	>250		
357	2-бром, 5-метил	251-252		
358	2-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-метилтіо	225-226		
359	2-хлор, 5-етокси	255-256		
360	2,5-дихлор, 4-нітро	225-226		
361	2,5-диметил, 4-метокси	233-234		

Таблиця індексів А (продовження)

Спол.	R **	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
362	2-C(CH ₃) ₃	175-176		
363	2-(CH=NOCH ₃)	200-201		
364	2,5-диметил, 4-йод	219-220		
365	2,5-диметил, 4-(C≡CSi(CH ₃) ₃)	201-202		
366	2,5-диметил, 4-(C≡CH)	171-172		
367	2-хлор, 5-ізопропокси	217-218		
368	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	219-220		
369	2,5-ди(C(O)N(CH ₃) ₂)	198-199		
370	2,5-ди(SO ₂ N(CH ₃) ₂)	171-172		
371	2-хлор, 5-OCH ₂ CF ₃	>250		
372	2,4-дихлор, 5-OCH ₂ C≡CH	202-203		
373	2-хлор, 5-аміно	195-196		
374	2-хлор, 5-гідрокси	139-140		
375	2-хлор, 5-NHC(O)CH ₃	206-207		
376	2-хлор, 5-OCH ₂ CH=CH ₂	251-252		
377	2-хлор, 5-OCH ₂ C≡CH	217-218		
378	2-хлор, 5-NHC(O)OCH ₃	255-256		
379	2-хлор, 5-бром	>250		
380	2-хлор, 5-(C≡CSi(CH ₃) ₃)	>250		
381	2-хлор, 5-(C≡CH)	238-240		
382 (Прикл. 3)	2-хлор, 5-етил	214-215		
383	2-хлор, 5-диметиламіно	>250		
384	2-метил, 5-диметиламіно	>250		
385	2-хлор, 4-бром, 5-метокси	224-225		
386	2-хлор, 4-ціано, 5-метокси	>250		
387	2-хлор, 4-бром, 5-метил	210-211		
388	2-хлор, 4-ціано, 5-метил	229-230		
389	2-хлор, 5-метилтіо	255-256		
390	3-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CH ₃	167-168		
391	NHC(O)NHCH ₃	188-189		
392	2-хлор, 5-OC(O)CH ₃	178-179		
393	3-NHC(O)(4-фторфеніл)	201-202		
394	2-метил, 5-ацетил	222-223		
395	2-бром, 5-пропіл	213-214		
396	2-пропіл, 5-бром	244-245		
397	2-бром, 5-ізопропіл	204-205		
398	2-ізопропіл, 5-бром	129-130		
399	2-етил, 5-хлор	219-220		
480	2-хлор, 5-трифторметокси	217-218		

* Дивись Таблицю Індексів Е для даних ¹Н ЯМР.

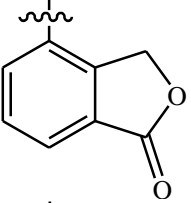
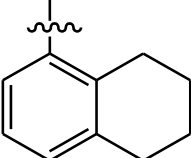
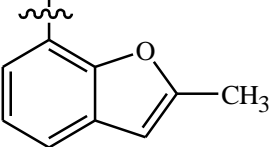
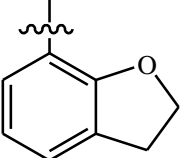
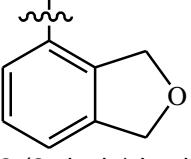
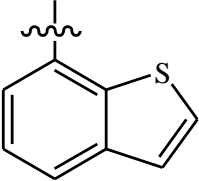
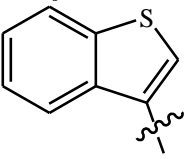
** “-” означає, що R являє собою Н (тобто фенільне кільце незаміщене)



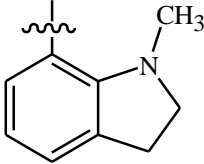
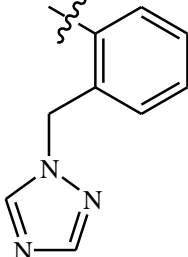
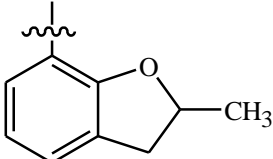
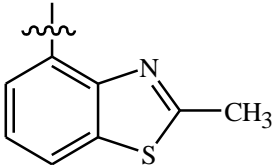
R^2 являє собою Н

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
152	3- CF_3 , 5-Cl	3-хлор-2-піридиніл	196-197		
153	3- CF_3 , 5-Cl	6-хлор-2-піридиніл	236-237		
154	3- CF_3 , 5-Cl	3-бром-2-піридиніл	192-193		
155	3- CF_3 , 5-Cl	3- CF_3 -6- OCH_3 -2-піридиніл	211-212		
156	3- CF_3 , 5-Cl	3- CO_2CH_3 -6- CF_3 -2-піридиніл	212-213		
157	3- CF_3 , 5-Cl	3- OCH_2CF_3 -6- CF_3 -2-піридиніл	244-245		
158	3- CF_3 , 5-Cl	3-йод-6-хлор-2-піридиніл	241-242		
159	3- CF_3 , 5-Cl	3- CF_3 -2-піридиніл	176-177		
160	3- CF_3 , 5-Cl	6- CF_3 -2-піридиніл	236-237		
161	3- CF_3 , 5-Cl	3- $C(O)N(CH_3)_2$ -6- CF_3 -2-піридиніл	152-153		
162	3- CF_3 , 5-Cl	4-хлор-3-піридиніл	196-197		
163	3- CF_3 , 5-Cl	2-хлор-3-піридиніл	194-195		
164	3- CF_3 , 5-Cl	2- SCH_2CH_3 -3-піридиніл	255-256		
165	3- CF_3 , 5-Cl	2- OCH_2CH_3 -3-піридиніл	192-193		
166	3- CF_3 , 5-Cl	4- CF_3 -2-піридиніл	229-230		
167	3- CF_3 , 5-Cl	2-хлор-5-тіазоліл	208-209		
168	3- CF_3 , 5-Cl	2-хлор-5-тієніл	216-217		
169	3- CF_3 , 5-Cl		252-253		
170	3- CF_3 , 5-Cl	1-метил-3-хлор-4-піразоліл	202-203		
171	3- CF_3 , 5-Cl	1-метил-4-хлор-3-піразоліл	>250		
172	3- CF_3 , 5-Cl	1-метил-5-хлор-4-піразоліл	>250		
173	3- CF_3 , 5-Cl		190-191		
174	3- CF_3 , 5-Cl	1-метил-5-етил-4-піразоліл	212-214		
175	3- CF_3 , 5-Cl	1,3,5-триметил-4-піразоліл	>250		
176	3- CF_3 , 5-Cl	2,4-диметил-5-тіазоліл	202-203		
177	3- CF_3 , 5-Cl	2-ціано-3-тієніл	251-252		
178	3- CF_3 , 5-Cl	2-метил-1,3,4-тіадіазол-5-іл	204-205		
179	3- CF_3 , 5-Cl	3-метил-2-тієніл	218-219		
180	3- CF_3 , 5-Cl	4-метил-2-тієніл	195-196		
181	3- CF_3 , 5-Cl	1-етил-5-піразоліл	169		
182	3- CF_3 , 5-Cl	1,5-диметил-4-піразоліл	242-243		
183	3- CF_3 , 5-Cl	4-метил-2-піридиніл	212-213		
184	3- CF_3 , 5-Cl	1-метил-5-піразоліл	176-177		

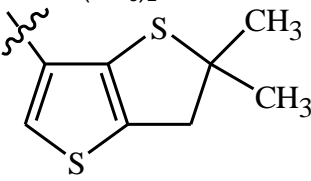
Таблиця індексів В (продовження)

R ² являє собою Н		Q		т.пл. (°C)		AP+	AP-
Спол.	(R ¹) _n					(M+1)	(M-1)
185	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-4-піразоліл		240-241			
186	3-CF ₃ , 5-Cl	2-фураніл		216-217			
187	3-CF ₃ , 5-Cl			>250			
188	3-CF ₃ , 5-Cl			210-211			
189	3-CF ₃ , 5-Cl			223-224			
190	3-CF ₃ , 5-Cl	3-нітро-2-тієніл		233-234			
191	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-4-SCH ₃ -5-піразоліл		178-179			
192	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-2SCH ₃ -3-піроліл		226-227			
193	3-CF ₃ , 5-Cl			233-235			
194	3-CF ₃ , 5-Cl			238-240			
195	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(2-тієніл)феніл		243-244			
196	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-5-SO ₂ CH ₃ -4-піразоліл		>250			
197	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(3-метил-1,2,4-оксадіазол-5-іл)		252-253			
198	3-CF ₃ , 5-Cl	2-ціано-3-бензотіазоліл		205-206			
199	3-CF ₃ , 5-Cl			243-244			
200	3-CF ₃ , 5-Cl			222-223			

Таблиця індексів В (продовження)

R ² являє собою Н		Q		AP+ AP-	
Спол.	(R ¹) _n			т.пл. (°C)	(M+1) (M-1)
201	3-CF ₃ , 5-Cl			206-207	
202	3-CF ₃ , 5-Cl			236-237	
203	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(3-метил-5-ізоксазоліл)феніл		234-235	
204	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(1-метил-4-піразоліл)феніл		211-212	
205	3-CF ₃ , 5-Cl	1-бензил-4-імідазоліл		>250	
206	3-CF ₃ , 5-Cl	1-бензил-4-піразоліл		226-227	
208	3-CF ₃ , 5-Cl	2-метил-4-CO ₂ CH ₃ -5-оксазоліл		171-172	
209	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-4-CO ₂ CH ₂ CH ₃ -3-піразоліл		>250	
210	3-CF ₃ , 5-Cl	1,3-диметил-5-CO ₂ CH ₃ -4-піразоліл		232-233	
211	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CO ₂ CH(CH ₃) ₂ -2-фураніл		173-174	
212	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-4-CON(CH ₃) ₂ -5-піразоліл		254-255	
213	3-CF ₃ , 5-Cl	1-ціано-3-нафталеніл		226-227	
214	3-CF ₃ , 5-Cl	1-ціано-4-нафталеніл		203-204	
215	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-5-CON(CH ₃) ₂ -4-піроліл		178-179	
216	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-3-(5-оксазоліл)-4-піразоліл		252-253	
217	3-CF ₃ , 5-Cl	3-метил-2-бензотієніл		229-230	
218	3-CF ₃ , 5-Cl			>250	
219	3-CF ₃ , 5-Cl	3-SO ₂ CH ₃ -2-фураніл		243-244	
220	3-CF ₃ , 5-Cl	2-(1,2,4-триазол-1-іл)-3-піридиніл		>250	
221	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CON(CH ₃) ₂ -2-тієніл		219-220	
222	3-CF ₃ , 5-Cl			246-247	
223	3-CF ₃ , 5-Cl	1-феніл-2-імідазоліл		211-212	
224	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CON(CH ₃) ₂ -3-фураніл		200-201	
225	3-CF ₃ , 5-Cl	3-CO ₂ CH ₃ -1,2,5-тіадіазол-4-іл		195-196	
226	3-CF ₃ , 5-Cl	4-CO ₂ CH ₃ -5-тіазоліл		220-221	
227	3-CF ₃ , 5-Cl	2-метил-1-нафталеніл		219-220	
228	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CO ₂ CH ₃ -3-тієніл		224-225	
229	3-Cl	феніл			334
230	3-Cl	4-метилфеніл		350	348
231	3-Cl	4-хлорфеніл			368

Таблиця індексів В (продовження)

R ² являє собою Н					
Спол.	(R ¹) _n	Q	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
232	3-Cl	4-метоксифеніл		366	364
233	3-Cl	4-ціанофеніл			359
234	3-Cl	3-хлорфеніл			368
237	3-Cl	3,5-дихлорфеніл			402
238	3-Cl	2,5-дихлорфеніл	230-232		
239	3-Cl	2-метил-4-фторфеніл	265-270		
240	3-Cl	2-метил-5-фторфеніл			366
241	3-CF ₃ , 5-Cl	2-піридиніл			403
242	3-Cl, 5-Cl	2-хлорфеніл		404	402
243	3-Cl, 5-Cl	2,5-дихлорфеніл		438	436
244	3-CF ₃ , 5-Cl	3-метил-2-піридиніл		419	417
245	3-CF ₃ , 5-Cl	2-тієніл		410	408
246	3-Cl, 5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		472	470
247	3-Cl, 5-Cl	2-хлор-6-метилфеніл		418	416
248	3-CF ₃	2-хлорфеніл		404	402
249	3-Cl	2-хлорфеніл			368
250	5-CF ₃	2-хлорфеніл		404	402
251	3-CF ₃ , 5-Cl	1,3-диметил-4-піразоліл	*		
252	3-Br, 5-Br	2-хлорфеніл		492	490
253	3-I	2-хлорфеніл		462	460
254	5-CN	2-хлорфеніл			359
255	3-CF ₃ , 5-Cl	3-хлор-2-тієніл			442
256	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-дихлор-3-тієніл		478	476
257	3-Br	2-хлорфеніл		414	412
258	3-CF ₃ , 5-Cl	3-бром-2-тієніл		490	488
259	-	2-хлорфеніл		336	334
260	3-CF ₃ , 5-Cl	2-CON(CH ₃) ₂ -3-тієніл			479
261	3-CF ₃ , 5-Cl			496	494
262	3-CF ₃ , 5-Cl	5-імідазоліл		394	392
263	3-CF ₃ , 5-Cl	4,5-дихлор-2-тієніл			476
264	3-CF ₃ , 5-Cl	5-бром-6-хлор-3-піридиніл			515
265	3-CF ₃ , 5-Cl	4,5-дибром-2-тієніл			564
266	3-CH ₃ , 5-Cl	3-метоксифеніл		380	378
267	3-CH ₃ , 5-Cl	2,5-диметилфеніл		378	376
268	3-CF ₃ , 5-Cl	4-бром-3-тієніл		488	
269	3-CH ₃ , 5-Cl	2-хлорфеніл		384	382
270	3-CH ₃ , 5-Cl	2-тієніл		356	354
271	3-CH ₃ , 5-Cl	3,5-диметил-4-ізоксазоліл		369	367
272	3-CF ₃ , 5-Cl	3-тієніл		410	408
273	3-CH ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		452	
274	3-CF ₃ , 5-Cl	5-хлор-1,3-диметил-4-піразоліл		456	454
275	3-CF ₃ , 5-Cl	1-метил-4-імідазоліл		408	406
276	3-CF ₃	3,5-диметил-4-ізоксазоліл		389	387
277	3-Br, 5-Br	3,5-диметил-4-ізоксазоліл		477	475

Таблиця індексів В (продовження)

R ² являє собою Н				AP+	AP-
Спол.	(R ¹) _n	Q	т.пл. (°C)	(M+1)	(M-1)
278	3-Br, 5-Br	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	*		
279	3-Br, 5-Br	2,5-диметилфеніл	*		
280	3-Br, 5-Br	2-тієніл	*		
281	3-Br, 5-Br	3-метоксифеніл	*		
282	3-CN	2-фторфеніл		345	343
283	3-CN	2-тієніл			331
284	3-CN	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	*		
285	3-CN	2,5-диметилфеніл			353
286	3-CN	2-хлорфеніл			359
287	3-CF ₃ , 5-CF ₃	2-фторфеніл		456	454
288	3-CF ₃ , 5-CF ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		540	
289	3-C(O)NH ₂	2-фторфеніл	*		
290	5-Cl	2-тієніл			340
291	3-CF ₃	2-тієніл		328	
292	3-CF ₃	2,5-диметилфеніл		398	396
293	5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		438	
294	5-Cl	2-хлорфеніл		370	368
295	5-Cl	2-фторфеніл		354	352
296	5-Cl	2,5-диметилфеніл		364	362
297	3-CF ₃	2,5-дибромфеніл		560	
298	3-CF ₃	2-фторфеніл		388	386
299	3-CF ₃	2-метилфеніл		384	382
300	3-CF ₃	2-хлор-4-(трифторметил)феніл		472	470
301	3-CF ₃	2-хлор-4-фторфеніл			420
302	2-CF ₃	2,5-диметилфеніл		398	396
303	2-CF ₃	2-хлорфеніл		404	402
304	2-CF ₃	2-тієніл		376	324
305	2-CF ₃	3-метоксифеніл		400	398
306	2-CF ₃	2-фторфеніл		388	386
307	4-CF ₃	2,5-диметилфеніл		398	396
308	4-CF ₃	2-хлорфеніл		404	402
309	4-CF ₃	2-тієніл		376	374
310	4-CF ₃	3-метоксифеніл		400	398
311	4-CF ₃	2-фторфеніл		388	386
312	2-CF ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		472	470
313	4-CF ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		472	470
314	3-CF ₃ , 5-Br	2-хлор-5-(трифторметил)феніл		550	548
315	3-CF ₃ , 5-Br	2-бром-5-(трифторметил)феніл	*		
316	3-CF ₃ , 5-Br	2-фторфеніл		466	465
400	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-дихлор-4-бром-3-тієніл	245-246		
401	3-CF ₃ , 5-Br	2-хлорфеніл	188-193		
403	3-CF ₃ , 5-Br	2,5-диметилфеніл	>250		
404	3-CF ₃ , 5-Br	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	224-225		
405	3-CF ₃ , 5-Br	4-ціано-2,5-диметилфеніл	193-194		
406	3-CF ₃ , 5-F	2,5-диметилфеніл	181-182		
407	3-CF ₃ , 5-F	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	186-187		
408	3-CF ₃ , 5-F	4-хлор-2,5-диметилфеніл	185-186		
409	3-CF ₃ , 5-F	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	176-177		

Таблиця індексів В (продовження)

R ² являє собою Н				AP+	AP-
Спол.	(R ¹) _n	Q	т.пл. (°C)	(M+1)	(M-1)
410	3-CF ₃ , 5-Br	4-хлор-2,5-диметилфеніл	190-191		
411	3-CF ₃ , 5-Br	4,5-диметокси-2-метилфеніл	110-111		
412	3-CF ₃ , 5-F	4,5-диметокси-2-метилфеніл	100-101		
413	3-CF ₃ , 5-Br	2-хлор-5-метоксифеніл	191-192		
(Прикл. 6)					
414	3-CF ₃ , 5-F	2-хлор-5-метоксифеніл	193-194		
415	3-CF ₃ , 5-F	4-ціано-2,5-диметилфеніл	206-207		
416	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	2,5-диметилфеніл	195-196		
417	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	189-190		
418	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	4-хлор-2,5-диметилфеніл	194-195		
419	3-CF ₃ , 5-OCH ₂ CH ₃	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	196-197		
420	3-CF ₃	5-ацетил-2-хлорфеніл	217-218		
421	3-CF ₃	4,5-диметокси-2-метилфеніл	164-165		
422	-	2-хлор-5-метоксифеніл	>250		
423	-	4-ціано-2,5-диметилфеніл	>250		
424	3-CF ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	>250		
425	-	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	239-240		
426	3-CF ₃ , 5-Cl	6-хлор-5-(трифторметил)-2-піридиніл	236-237		
427	3-CF ₃	4-ціано-5-метокси-2-метилфеніл	227-228		
432	-	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	>250		
433	3-CF ₃ , 5-Cl	3-метил-6-метиламіно-2-піридиніл	>250		
434	3-CF ₃ , 5-Cl	3-хлор-6-метиламіно-2-піридиніл	190-191		
435	3-CF ₃ , 5-Cl	3-ціано-4,6-диметил-2-піридиніл	195-196		
436	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-дихлор-6-диметиламіно-2-піридиніл	238-239		
437	3-CF ₃ , 5-Cl	3-йод-6-метиламіно-2-піридиніл	156-157		
438	-	2-бром-5-(трифторметил)феніл	>250		
439	3-CF ₃	5-метокси-2-метилфеніл	179-180		
440	3-CF ₃	2-ацетиламіно-4-метил-5-тіазоліл	248-249		
445	3-CF ₃ , 5-CN	2,5-диметилфеніл	202-203		
446	3-CF ₃ , 5-Cl	6-диметиламіно-3-йод-2-піридиніл	179-180		
447	3-CF ₃ , 5-C(O)NH ₂	4-ціано-2,5-диметилфеніл	>250		
448	3-CF ₃ , 5-CN	2-ціано-5-(трифторметил)феніл	*		
449	3-CF ₃	2-хлор-5-етоксифеніл	224-225		
451	3-CF ₃ , 5-SCH ₂ CH ₃	2-хлор-5-метоксифеніл	195-196		
455	3-CF ₃ , 5-Cl	5-(2-метоксіетил)-2-тієніл	167-168		
456	3-CF ₃ , 5-Cl	2-ацетил-3-тієніл	178-179		
457	3-CF ₃ , 5-Cl	4-нітро-2-тієніл	192-193		
458	3-CF ₃ , 5-CH ₃	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	184-185		
459	3-CF ₃ , 5-CH ₃	2,5-диметилфеніл	235-236		
460	3-CF ₃	2-хлор-5-метилфеніл	219-220		
461	3-CF ₃	5-метил-2-нітрофеніл	>250		
462	3-CF ₃	2-хлор-5-етилфеніл	217-218		
463	3-CF ₃	5-C(CH ₃) ₃ -2-нітрофеніл	202-203		
464	3-CF ₃ , 5-Cl	5-метил-4-ізоксазоліл	170-171		
465	3-CF ₃ , 5-Cl	1-етил-3-метил-4-імідазоліл	189-190		
(Прикл. 4)					
466	3-CF ₃	1-етил-3-метил-4-імідазоліл	148-149		
467	3-CF ₃	5-бром-2-хлорфеніл	>250		

Таблиця індексів В (продовження)

R^2 являє собою Н

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
468	3-CF ₃	2-бром-5-(трифторметил)феніл	>250		
469	3-CF ₃	5-метокси-2-нітрофеніл	228-229		
470	3-CF ₃	5-ацетил-2-метилфеніл	206-207		
471	3-CF ₃	2-бром-5-пропілфеніл	189-190		
474 (Прикл. 5)	3-CF ₃ , 5-Cl	3-хлор-1-етил-4-імідазоліл	184-185		
475	3-CF ₃ , 5-Cl	3-хлор-1-ізопропіл-4-імідазоліл	221-222		
476	3-CF ₃ , 5-Cl	1-ізопропіл-3-метил-4-імідазоліл	163-164		

* Дивись Таблицю Індексів Е для даних ^1H ЯМР.

R^2 являє собою Br

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)	AP+ (M+1)	AP- (M-1)
317	3-CF ₃ , 5-Cl	2-фторфеніл	*		
318	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл			582
402	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-диметилфеніл	189-190		
441	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-метоксифеніл	202-203		
442	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	194-195		
443	3-CF ₃ , 5-Cl	4-ціано-5-метокси-2-метилфеніл	232-233		
444	3-CF ₃ , 5-Cl	4-ціано-2,5-диметилфеніл	108-109		

*Дивись Таблицю Індексів Е для даних ^1H ЯМР.

5

R^2 являє собою CH₃

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)
428	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-диметилфеніл	191-192
429	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	229-230
430	3-CF ₃ , 5-Cl	3,5-диметил-4-ізоксазоліл	176-177
431 (Прикл. 7)	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-метоксифеніл	222-223
472	3-CF ₃	2-хлор-5-метоксифеніл	222-223
473	3-CF ₃	2-бром-5-пропілфеніл	204-205

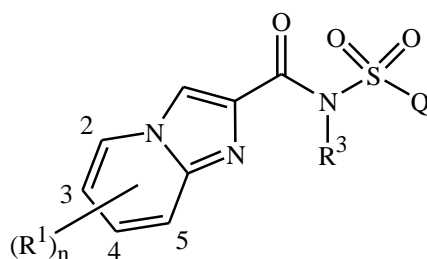
R^2 являє собою CN

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)
450	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-диметилфеніл	>250

R^2 являє собою CH₂CH₃

Спол.	$(R^1)_n$	Q	т.пл. (°C)
452	3-CF ₃ , 5-Cl	2,5-диметилфеніл	202-203
453	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-(трифторметил)феніл	188-189
454	3-CF ₃ , 5-Cl	2-хлор-5-метоксифеніл	161-162

Таблиця індексів С



Спол.	(R ¹) _n	R ³	Q	т.пл. (°C)
320	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₃	4-метилфеніл	*
321	3-Cl	CH ₃	4-метилфеніл	*
322	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₃	2-хлорфеніл	*
323	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CH ₃	2-хлорфеніл	*
324	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CF ₃	2-хлорфеніл	*
325	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ C≡CH	2-хлорфеніл	*
326	3-CF ₃ , 5-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	2-хлорфеніл	*

* Дивись Таблицю Індексів Е для даних ¹Н ЯМР.

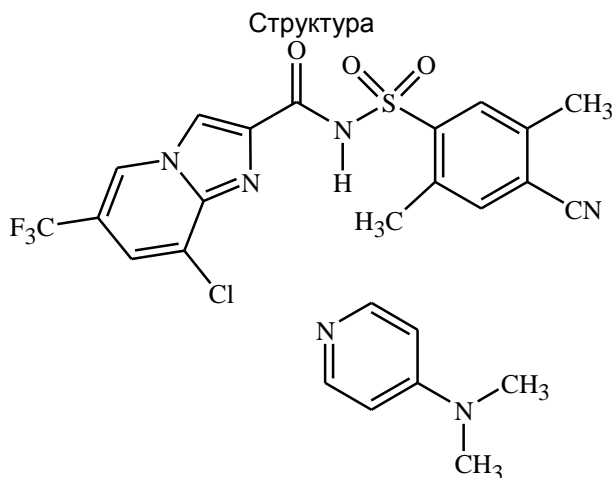
Таблиця індексів D

Спол.	Структура	т.пл. (°C)
328		*
477		>250
478		>250

Таблиця індексів D (продовження)

Спол.
479

Структура

т.пл. (°C)
185-186* Дивись Таблицю Індексів Е для даних ^1H ЯМР.

Таблиця індексів Е

№ спол.	Дані ^1H ЯМР ^a
322	δ (ацетон- d_6) 9,15 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 3,98 (s, 3H).
323	δ (ацетон- d_6) 9,15 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 4,73 (q, 2H), 1,56 (t, 3H).
324	δ (ацетон- d_6) 9,17 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,8-7,65 (m, 3H), 6,0 (br s, 2H).
325	δ (ацетон- d_6) 9,18 (s, 1H), 8,66 (s, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 5,71 (s, 2H), 2,83 (s, 1H).
326	δ (ацетон- d_6) 9,14 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 4H), 6,2 (m, 1H), 5,46 (s, 2H), 5,4 (d, 1H), 5,2 (d, 1H).
108	δ (ацетон- d_6) 11,25 (br s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,15 (t, 1H), 7,8 (m, 2H), 7,5 (t, 1H), 7,4 (dd, 1H).
140	δ (dmso- d_6) 9,29 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,64-7,48 (m, 3H), 7,29 (d, 1H), 3,88-3,78 (m, 3H).
319	δ (dmso- d_6) 9,33 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,96 (s, 2H).
278	δ (dmso- d_6) 9,03 (d, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,37 (d, 1H), 8,09 (dd, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,92 (d, 1H).
279	δ (dmso- d_6) 9,01 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,47-7,35 (m, 1H), 7,28 (d, 1H), 2,57 (s, 3H), 2,37 (s, 3H).
280	δ (dmso- d_6) 9,04-9,01 (m, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,05 (dd, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,22 (dd, 1H).
281	δ (dmso- d_6) 8,98 (d, 1H), 8,58 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,67-7,48 (m, 3H), 7,27 (s, 1H), 3,83 (s, 3H).
284	δ (dmso- d_6) 9,47 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,99 (br s, 1H), 7,83 (br s, 3H).
289	δ (dmso- d_6) 9,23 (br s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,22 (br s, 2H), 7,93 (br s, 2H), 7,66 (br s, 3H), 7,33 (br s, 2H).
297	δ (dmso- d_6) 9,34 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,81 (d, 2H).
317	δ (dmso- d_6) 8,63 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,51-7,42 (m, 1H), 7,24 (m, 1H), 7,17 (d, 1H).
328	δ (dmso- d_6) 9,29 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,45-8,34 (m, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,70 (dd, 1H).
251	δ 8,46 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 3,86 (s, 3H), 2,48 (s, 3H).
315	δ (dmso- d_6) 9,35 (d, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,39 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,97 (s, 1H).
448	δ (dmso- d_6) 9,57 (br s, 1H), 8,73 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,96 (s, 1H).

Таблиця індексів Е (продовження)

№ спол.	Дані ^1H ЯМР ^a
320	δ 8,48 (m, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,07 (m, 2H), 7,48 (m, 1H), 7,37 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,45 (s, 3H).
321	δ 8,16 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,99 (m, 2H), 7,57 (m, 2H), 7,34 (m, 2H), 7,23 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 2,43 (s, 3H).

^a Дані ^1H ЯМР представлено в частинах на мільйон слабкого поля від тетраметилсилану. Розчин CDCl_3 , якщо не зазначене інше; "ацетон- d_6 " являє собою $\text{CD}_3\text{C}(=\text{O})\text{CD}_3$; "dms d_6 " являє собою $\text{CD}_3\text{S}(=\text{O})\text{CD}_3$. Взаємодії позначені як (s)- синглет, (d)- дуплет, (t)-триплет, (m)- мультиплет, (dd)- дуплет дуплетів, (br s)- широкий синглет.

У наступних Тестах показана ефективність контролю у сполук даного винаходу на конкретних шкідників. "Ефективність контролю" представляє інгібування розвитку паразитичної нематоди (включаючи смертність), яке спричиняє істотно знижене живлення. Проте, захист завдяки контролю за шкідниками, що забезпечується даними сполуками, не обмежується цими зразками.

Біологічні приклади даного винаходу

Тест А

10 Контроль південної галової нематоди (*Meloidogyne incognita*) шляхом контакту та/або системними способами оцінювали в випробувальних стендах, що складаються з невеликих відкритих контейнерів, заповнених сумішшю піщаного ґрунту та сіянцями огірка.

15 Тестові сполуки було складено з застосуванням розчину, який містив 50% ацетону та 50% води. Тестові сполуки вносили безпосередньо в ґрунт випробувальних стендів в концентраціях активного інгредієнта 250 або 50 частин на мільйон. Кожний тест повторювали 3 рази. Після обробки випробувальним стендам дозволяли висохнути протягом 1 години, після чого приблизно 250 ювенільних (J2) личинок другої стадії вносили за допомогою піпетки в ґрунт. Випробувальні стенди витримували при 27°C і зволожували, у разі потреби, протягом 7 днів.

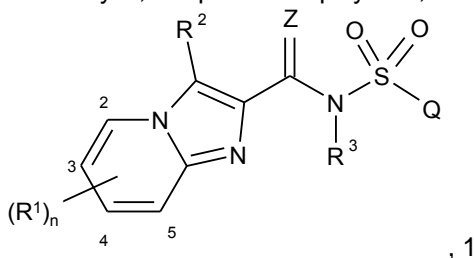
20 Нематодцидну ефективність визначали за величиною утворення кореневого гала, яке спостерігалось, порівняно з необробленим контролем. Не спостерігалось характерного утворення гала при 100% контролю нематоди. Утворення гала, еквівалентне виявленому у необробленому контролі, було характерним для 0% контролю. Не давали оцінку контролю нематоди для сполук, що виявляють істотну фітотоксичність.

25 Зі сполук, протестованих при концентрації 250 частин на мільйон, наступні забезпечили гарні рівні захисту рослини (50% або більше зменшення утворення кореневого гала у порівнянні з контролями, обробленими розчинниками) і не виявляли істотної фітотоксичності: 4, 5, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 17, 19, 24, 25, 28, 29, 30, 32, 34, 38, 57, 59, 63, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 75, 83, 89, 90, 93, 101, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 116, 117, 120, 126, 130, 131, 132, 133, 134, 136, 137, 139, 140, 143, 145, 149, 152, 157, 159, 162, 163, 167, 169, 170, 171, 172, 174, 30 175, 176, 179, 180, 181, 184, 186, 188, 193, 206, 241, 244, 245, 248, 251, 252, 253, 257, 258, 259, 272, 274, 279, 285, 292, 294, 297, 298, 299, 301, 313, 314, 315, 317, 318, 319, 323, 329, 331, 332, 333, 334, 340, 341, 342, 344, 345, 347, 348, 355, 359, 360, 361, 364, 365, 366, 367, 371, 372, 373, 375, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 393, 394, 395, 396, 397, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 409, 410, 411, 412, 413, 414, 415, 417, 418, 419, 420, 421, 422, 424, 425, 35 426, 427, 429, 430, 436, 439, 441, 442, 443, 444, 445, 449, 450, 451, 458, 459, 460, 461, 462, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 474, 475, 476, 477, 478 і 479.

40 Зі сполук, протестованих при концентрації 50 частин на мільйон, наступні забезпечили гарні рівні захисту рослини (50% або більше зменшення утворення кореневого гала в порівнянні з контролями, обробленими розчинниками) і не виявляли істотної фітотоксичності: 2, 4, 7, 9, 10, 11, 13, 19, 30, 59, 63, 66, 67, 68, 69, 71, 73, 86, 90, 94, 101, 103, 105, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 116, 117, 130, 132, 133, 137, 139, 140, 143, 149, 151, 157, 162, 163, 167, 170, 175, 176, 179, 180, 241, 245, 248, 251, 252, 258, 259, 268, 272, 274, 279, 292, 297, 298, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 329, 331, 332, 337, 341, 342, 343, 348, 356, 357, 359, 366, 367, 371, 372, 373, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 386, 388, 394, 395, 396, 397, 401, 402, 403, 405, 406, 407, 408, 410, 411, 45 413, 414, 415, 416, 419, 420, 424, 427, 428, 429, 430, 431, 436, 439, 441, 442, 443, 444, 445, 449, 451, 458, 459, 460, 462, 465, 466, 467, 469, 470, 471, 474, 475, 477, 478 і 479.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука, вибрана з Формули 1, її N-оксид або сіль:



де

Z являє собою O або S;

кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_2 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

R^2 являє собою H, галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

R^3 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$,

$$\text{OC(O)OR}^8, \text{OC(O)NR}^{11}\text{R}^{12}, \text{OS(O)}_2\text{R}^9, \text{OS(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}, \text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^7, \text{N(R}^{10})\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12},$$

$$\text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{R}^9, \text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12} \text{ i R}^{14};$$

кожний X незалежно являє собою O або S ;

кожний R^4 незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

кожний R^{4a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

кожний R⁵ незалежно являє собою H, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

кожний R^{5a} незалежно являє собою Н або C₁-C₆алкіл;

кожний R⁶ незалежно являє собою H, C₁-С₆алкіл, C₁-С₆галогеналкіл, C₂-С₆алкеніл, C₂-С₆галогеналкеніл, C₂-С₆алкініл або C₂-С₆галогеналкініл; або C₃-С₇циклоалкіл, C₄-С₈циклоалкілалкіл, C₆-С₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-С₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}.

кожний R^{6a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, $C(O)R^{13}$ або $C(O)OR^{13}$.

кожний R^7 незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; кожний R^{7a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл;

кожний R^8 незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоген

C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл або C₂-C₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксилалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і NR¹⁰(C(O)R^{7a}).

кожний R^{8a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл;

кожний R⁹ незалежно являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл, кожний R^{9a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}, або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл або C₂-C₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹², або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкініл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}, кожний R^{9a} незалежно являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

- кожний R^{10} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$;
- кожний R^{10a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл;
- кожний R^{11} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{11a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл;
- кожний R^{12} незалежно являє собою H , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{13} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$;
- кожний R^{14} незалежно являє собою C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{15} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_4 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; і
- n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;
- за умови, коли n дорівнює 2 і один R^1 являє собою CF_3 у 3-положенні Формули 1, а інший R^1 являє собою Cl у 5-положенні Формули 1, і R^2 і R^3 являють собою H , тоді Q є відмінним від 2-хлорфенілу, 2-хлор-6-метилфенілу, 2,6-дихлорфенілу, 2-хлор-4-фторфенілу, 2,5-біс(2,2,2-трифторетокси)фенілу, 2,4,6-трихлорфенілу, 2-хлор-5-(трифторметил)фенілу або 3,5-диметил-4-ізоксазолілу.
2. Сполука за п. 1, де:
- Z являє собою O ; і
- Q являє собою феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро,

OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

3. Сполука за п. 2, де:

5 Q являє собою феніл, піридил, піразоліл, оксазоліл, тiazоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, фураніл або тієніл, кожний факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $C(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.

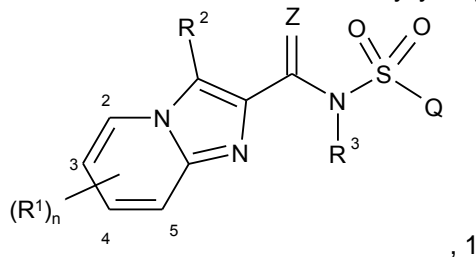
4. Сполука за п. 2 або п. 3, де:

10 кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, OR^4 , C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл; R^2 являє собою H, галоген або C_1 - C_6 алкіл; R^3 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ або $S(O)_mR^9$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 OR^4 ; і n дорівнює 1 або 2.

5. Сполука за п. 1, яка вибрана з групи, що включає:

15 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
8-хлор-N-[(4-ціано-2,5-диметилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
N-[(5-ацетил-2-хлорфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
20 8-хлор-N-[(3-метил-2-тієніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
8-хлор-N-[(4-метил-2-тієніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
8-хлор-N-[(3-хлор-1-метил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
25 8-хлор-N-[(5-метокси-2-нітрофеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід;
8-хлор-N-[(2-хлор-5-етилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
8-хлор-N-[(1-етил-3-метил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
30 8-бром-N-[(2-хлор-5-метоксифеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
N-[(2-бром-5-метилфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
35 8-хлор-N-[(2-хлор-5-метилфеніл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід,
8-хлор-N-[(3-хлор-1-етил-1H-піразол-4-іл)сульфоніл]-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід і
N-[(5-ацетил-2-метилфеніл)сульфоніл]-8-хлор-6-(трифторметил)-імідазо[1,2-a]піридин-2-карбоксамід.
40

6. Композиція, що містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль:



де

Z являє собою O або S;

45 кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$, або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або

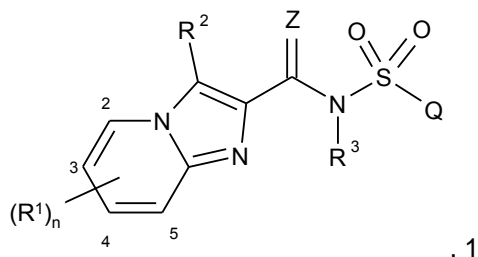
- 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$.
- 5 R^2 являє собою H, галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$, або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 10 R^3 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 20 або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 25 Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$, $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$ і R^{14} ;
- 30 кожний X незалежно являє собою O або S; кожний R^4 незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 45 кожний R^{4a} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл; кожний R^5 незалежно являє собою H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 50 кожний R^{5a} незалежно являє собою H або C_1 - C_6 алкіл;
- 55 кожний R^{6a} незалежно являє собою H або C_1 - C_6 алкіл;

[illegible]

- галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $C(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{13} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$;
- кожний R^{14} незалежно являє собою C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{15} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; і n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;
- і щонайменше один додатковий компонент, вибраний із групи, що включає поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі та рідкі розріджувачі.
7. Композиція за п. 6, де зазначена композиція додатково містить щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.
8. Композиція за п. 7, де щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб вибрано з групи, що включає абамектин, ацефат, ацеквіноцил, ацетаміприд, акринатрин, амідофлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діелдрин, дифлубензулон, димефлутрин, димегіпо, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатину оксид, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флувалінат, тау-флувалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, інсектицидні мила, ізофенфос, луфенурон, малатіон, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метидатіон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, фортат, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензулон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон, усі штами *Bacillus thuringiensis*, ентомопатогенні бактерії, усі штами вірусів ядерного поліедрозу, ентомопатогенні віруси та ентомопатогенні гриби.
9. Композиція за п. 8, де щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб вибрано з групи, що включає абамектин, ацетаміприд, акринатрин, амітраз, авермектин, азадирахтин, біфентрин, бупрофезин, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-

цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діелдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флувалінат, форметанат, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, луфенурон, метафлумізон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумурон, усі штами *Bacillus thuringiensis* і всі

штами вірусів ядерного поліедрозу.
10. Спосіб контролю паразитичної нематоди, що включає контакт паразитичної нематоди або її навколишнього середовища з біологічно ефективною кількістю сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі:



де

Z являє собою O або S;

кожний R¹ незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹R¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹ або N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹², або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C₂-C₆алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}.

R² являє собою H, галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹R¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹ або N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹², або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C₂-C₆алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}.

R³ являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₁-C₆алкіл, заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C₂-C₆алкоксіалкіл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

5 Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, SF₅, OCN, SCN, Si(R¹⁵)₃, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷,
10 OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹R¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹R¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)S(O)₂R⁹, N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹R¹² і R¹⁴;

кожний X незалежно являє собою O або S ;

кожний R⁴ незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл або C₂-C₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} або S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a}; i N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

кожний R^{4a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

кожний R⁵ незалежно являє собою H, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆ алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a};

кожний R^{5a} незалежно являє собою Н або C₁-C₆алкіл;

кожний R⁶ незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a};

кожний R^{6a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C(O)R¹³ або C(O)OR¹³,

кожний R^7 незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; кожний R^{7a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл;

кожний R⁸ незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл або C₂-C₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹², або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}, кожний R^{8a} незалежно являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

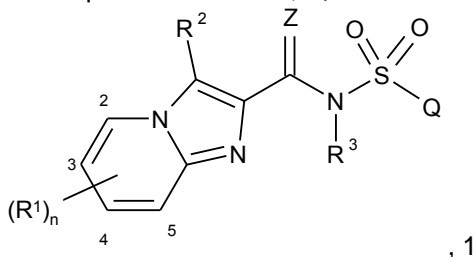
кожний R^9 незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно

- заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, факультативно
- 5 заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; кожний R^{9a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл; кожний R^{10} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$;
- 10 кожний R^{10a} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; кожний R^{11} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно
- 15 заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;
- 20 кожний R^{11a} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл; кожний R^{12} незалежно являє собою H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з
- 25 групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;
- 30 кожний R^{13} незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$;
- 35 кожний R^{14} незалежно являє собою C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 40 кожний R^{15} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з
- 45 групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- 50 кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; i n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4.
- 55 11. Спосіб за п. 10, де навколишнім середовищем є рослина.
- 60

12. Спосіб за п. 10, де навколишнім середовищем є насіння.

13. Спосіб за п. 12, де насіння покривають сполукою Формули 1, її N-оксидом або сіллю, складеними у вигляді композиції, що містить плівкоутворювач або адгезивний засіб.

14. Оброблене насіння, що містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль:



де

Z являє собою O або S;

кожний R^1 незалежно являє собою галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^2 являє собою H, галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$, $OC(O)OR^8$, $OC(O)NR^{11}R^{12}$, $OS(O)_2R^9$, $OS(O)_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})C(O)R^7$, $N(R^{10})C(O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{10})S(O)_2R^9$ або $N(R^{10})S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

R^3 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_1 - C_6 алкіл, заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає феніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

Q являє собою феніл, нафталеніл, 5- або 6-членне гетероароматичне кільце або 8-10-членну гетероароматичну біциклічну кільцеву систему, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^{15})_3$, OR^4 , NR^5R^6 , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$,

$$\text{OC(O)OR}^8, \text{OC(O)NR}^{11}\text{R}^{12}, \text{OS(O)}_2\text{R}^9, \text{OS(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}, \text{N(R}^{10})\text{C(O)R}^7, \text{N(R}^{10})\text{C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}, \\ \text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{R}^9, \text{N(R}^{10})\text{S(O)}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12} \text{ i R}^{14};$$

кожний X незалежно являє собою O або S ;

кожний R^4 незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;

кожний R^{4a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

кожний R⁵ незалежно являє собою H, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₂-C₆галогеналкініл, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ або S(O)₂NR¹¹R¹²; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}.

кожний R^{5a} незалежно являє собою H або C₁-C₆алкіл;

кожний R⁶ незалежно являє собою H, C₁-С₆алкіл, C₁-С₆галогеналкіл, C₂-С₆алкеніл, C₂-С₆галогеналкеніл, C₂-С₆алкініл або C₂-С₆галогеналкініл; або C₃-С₇циклоалкіл, C₄-С₈циклоалкілалкіл, C₆-С₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-С₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}.

кожний R^{6a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, $C(O)R^{13}$ або $C(O)OR^{13}$.

кожний R^7 незалежно являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$; кожний R^{7a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл;

кожний R^8 незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоген

С₆галогеналкеніл, С₂-С₆алкініл або С₂-С₆галогеналкініл; або С₃-С₇циклоалкіл, С₄-С₈циклоалкілалкіл, С₆-С₁₄циклоалкілциклоалкіл або С₅-С₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, С₁-С₄алкіл, С₁-С₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}; або С₁-С₆алкіл, С₂-С₆алкеніл або С₂-С₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹²; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, С₁-С₄алкіл, С₂-С₄алкеніл, С₂-С₄алкініл, С₁-С₄галогеналкіл, С₂-С₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, С₂-С₆алкоксилалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і NR¹⁰C(O)R^{7a}.

кожний R^{8a} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл;

кожний R⁹ незалежно являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл, кожний R^{9a} незалежно являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл або C₂-C₆галогеналкініл; або C₃-C₇циклоалкіл, C₄-C₈циклоалкілалкіл, C₆-C₁₄циклоалкілциклоалкіл або C₅-C₇циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, OR^{4a} і S(O)_mR^{9a}, або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл або C₂-C₆алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR⁴, NR⁵R⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ і S(O)₂NR¹¹R¹², або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C₁-C₄алкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₄галогеналкіл, C₂-C₄галогеналкеніл, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², OR^{4a}, C₂-C₆алкоксіалкіл, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR¹¹R¹², NR^{5a}R^{6a}, OC(O)R^{7a} і N(R¹⁰)C(O)R^{7a}, кожний R^{9a} незалежно являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл;

- кожний R^{10} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$;
- кожний R^{10a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл;
- кожний R^{11} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ або $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10a})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{11a} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл;
- кожний R^{12} незалежно являє собою H , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ або $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11a}R^{12}$, OR^{4a} , C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11a}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $C(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{13} незалежно являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$;
- кожний R^{14} незалежно являє собою C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл, C_6 - C_{14} циклоалкілциклоалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл або C_2 - C_6 алкініл, кожний заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає ціано, нітро, OR^4 , $NR^{5a}R^{6a}$, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ і $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; або феніл, нафталеніл або 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, кожне факультативно заміщене 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $C(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожний R^{15} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл або C_2 - C_6 галогеналкініл; або C_3 - C_7 циклоалкіл, C_4 - C_8 циклоалкілалкіл або C_5 - C_7 циклоалкеніл, кожний факультативно заміщений 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, OR^{4a} і $S(O)_mR^{9a}$; або феніл, факультативно заміщений 1-5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціано, нітро, OR^4 , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_2 - C_4 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкоксіалкіл, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ і $N(R^{10})C(O)R^{7a}$;
- кожне m незалежно дорівнює 0, 1 або 2; і
- n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;
- у кількості від приблизно 0,0001 до 1 % за масою насіння перед обробкою.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

Міністерство розвитку економіки, торгівлі та сільського господарства України,
вул. М. Грушевського, 12/2, м. Київ, 01008, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601