



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 122326

(13) C2

(51) МПК

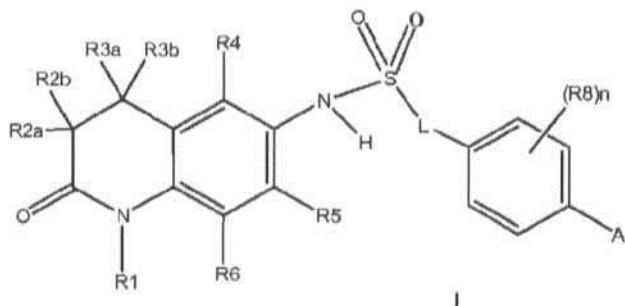
C07D 215/227 (2006.01)

A01N 43/42 (2006.01)

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2017 02156	(72) Винахідник(и):	Луазелер Олів'є (CH), Вендеборн Себастьян Фолькер (CH), Катлер Шон Р. (US)
(22) Дата подання заявки:	07.08.2015	(73) Володілець (володільці):	ДЗЕ РІДЖЕНТС ОФ ДЗЕ ЮНІВЕРСІТІ ОФ КАЛІФОРНІЯ, 1111 Franklin Street, Twelfth Floor, Oakland, CA 94607-5200, United States of America (US), СІНДЖЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	27.10.2020	(74) Представник:	Бочаров Максим Анатолійович, реєстр. №367
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	62/035,310	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2015/155154 A1, 15.10.2015 WO 2014/210555 A1, 31.12.2014 WO 2013/148339 A1, 03.10.2013
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	08.08.2014		
(33) Код держави-учасниці Парижської конвенції, до якої подано попередню заявку:	US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.07.2017, Бюл.№ 13		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	26.10.2020, Бюл.№ 20		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2015/044192, 07.08.2015		

(54) 2-ОКСО-3,4-ДИГІДРОХІНОЛІН-6-ІЛСУЛЬФОНАМІДИ І ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ЯК РЕГУЛЯТОРІВ РОСТУ РОСЛИН**(57) Реферат:**

Цей винахід стосується нових похідних сульфонаміду формули (I), в якій замісники R1-R6 і R8, L, A і n є такими, як визначено в цьому винаході, композицій регулятора росту рослин, що їх містять, і способів їх застосування для регулювання росту рослин, покращення стійкості рослини до абіотичного стресу (включаючи стреси під впливом навколишнього середовища і

UA 122326 C2

хімічні стреси), пригнічення проростання насіння та/або захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів.

ПЕРЕХРЕСНЕ ПОСИЛАННЯ НА СПОРІДНЕНІ ЗАЯВКИ

[0001] На підставі цієї заявки відповідно до 35 USC 119(e) подається запит на пріоритет за попередньою заявкою US № 62/035310, поданою 8 серпня 2014 р., яка у своїй повноті включена у цей винахід як посилання для всіх об'єктів.

ГАЛУЗЬ, ДО ЯКОЇ НАЛЕЖИТЬ ВІНАХІД

[0002] Цей винахід відноситься до нових похідних сульфонамідів, способів і проміжних продуктів для їх отримання, композицій регулятора росту рослин, що їх містять, і способів їх застосування для регулювання росту рослин, покращення стійкості рослини до абіотичного стресу (включаючи стреси під впливом навколишнього середовища і хімічні стреси), пригнічення проростання насіння та/або захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів.

РІВЕНЬ ТЕХНІКИ

[0003] Абсцизова кислота (ABA) є рослинним гормоном, який відіграє головну роль у зростанні і розвитку рослини, і відповіді на абіотичний стрес. ABA призводить до багатьох з його клітинних відповідей шляхом зв'язування з родиною розчинних рецепторів, які мають назву білків PYR/PYL і які містять зв'язуючу ліганди кишеню для ABA і інших агоністів. Продемонстровано, що пряме нанесення ABA на рослини призводить до покращення ефективності використання ними води. Проте ABA важко і дорого отримувати і сама вона нестабільна в умовах навколишнього середовища, і тому нестабільна при використанні у сільському господарстві у промисловому масштабі. Тому бажано розробити агоністи ABA, які можна використовувати для покращення стійкості рослини до стресу під впливом навколишнього середовища, такого як посуха, пригнічення проростання насіння, регулювання росту рослин, і підвищення врожайності сільськогосподарської культури.

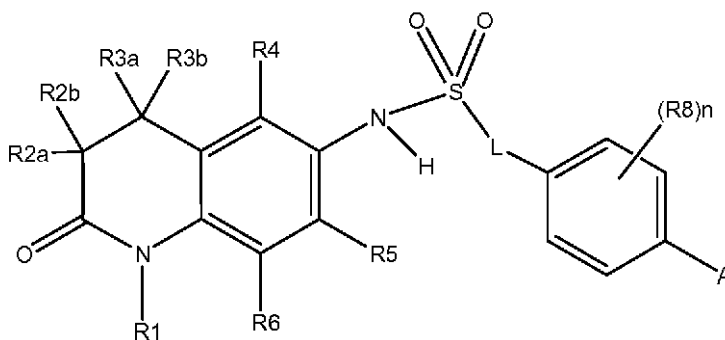
[0004] У WO2013/148339 описаний новий агоніст ABA - хінабактин - який зв'язується з рецепторними білками PYR/PRL і призводить до утворення абсцизової кислоти *in vivo*. Продемонстровано, що хінабактин призводить до закривання продихів, зниження втрат води і стимулює стійкість до посухи.

[0005] Необхідно виявити покращені агоністи абсцизової кислоти для покращення росту і розвитку рослини, і стійкості рослини до стресів під впливом навколишнього середовища. Цей винахід відноситься до нових аналогів хінабактину, які володіють покращеними характеристиками. Переваги сполук, запропонованих у цьому винаході, включають підвищену стійкість до абіотичних стресів, покращене пригнічення проростання насіння, покращене регулювання росту рослин, покращену врожайність сільськогосподарської культури та/або покращені фізичні характеристики, що призводять до покращення споживання води, покращеним розчинністю у воді, хімічній стабільності або фізичній стабільності.

СУТЬ ВІНАХОДУ

[0006] Винахід відноситься до нових похідних сульфонамідів, способів і проміжних продуктів для їх отримання, композицій, що їх містять, і способів їх застосування.

[0007] Одним об'єктом цього винаходу є сполука формули (I):



I

або її солі або N-оксиди. R1 обраний з групи, що включає водень, алкіл, ціаноалкіл, галогеналкіл, алкоксилалкіл, галогеналкоксилалкіл, циклоалкілалкіл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл і гетероциклоалкіл; або R1 обраний з групи, що включає алкіларил, циклоалкіл, феніл і гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 R_x. Кожен R_x незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл і циклоалкіл. R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, галогеналкіл, галогеналкоксигрупу і циклоалкіл. R2a і R2b, або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням

циклоалкілу. L обраний з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкоксигрупу і алкоксіалкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл і алкоксигрупу. A означає циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 R_y. Кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, алкіл, галогеналкіл, –OH, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, циклоалкіл, =O, =N–OH, –N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR_{9a}R₉ та NHCOR₉. Якщо один або більша кількість R_y означають =O, =N–OH або –N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл. R₉ і R_{9a} незалежно означають алкіл. Кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл, циклоалкіл і алкоксіалкіл. n обраний з групи, що включає 1, 2 і 3.

[0008] Сполуки, запропоновані у цьому винаході, можуть існувати у вигляді різних геометричних або оптичних ізомерів (діастереоізомерів і енантіомерів) або таутомерних форм. В обсяг цього винаходу входять всі такі ізомери і таутомери і їх суміші у всіх співвідношеннях, а також ізотопозаміщені форми, такі як дейтеровані сполуки. В обсяг цього винаходу також входять всі солі, N-оксиди і металоїдні комплекси сполук, які запропоновані у цьому винаході.

[0009] В інших об'єктах, цей винахід стосується складів цих сполук, відповідним чином приготованих для введення у рослини, і способів застосування цих сполук і складів.

[0010] Інші об'єкти, переваги та особливості цього винаходу стануть зрозумілими з подальшого докладного опису.

ДОКЛАДНИЙ ОПИС ВИНАХОДУ

Визначення

[0011] Перш ніж цей винахід буде описано більш докладно, слід розуміти, що цей винахід не обмежується конкретними варіантами реалізації, описаними у цьому винаході, оскільки такі варіанти реалізації можуть змінюватися. Також слід розуміти, що термінологія, що використовується у цьому винаході, призначена для опису тільки переважних варіантів реалізації і не призначена для накладення обмежень. Обсяг цього винаходу обмежений лише доданою формулою винаходу. Якщо не наведені інші визначення, то всі технічні та наукові терміни, що використовуються у цьому винаході, мають такі самі значення, які зазвичай відомі фахівцеві із загальною підготовкою у галузі техніки, до якої належить цей винахід. Якщо наведено діапазон значень, слід розуміти, що кожне проміжне значення з точністю до десятої частини нижнього граничного значення (якщо з контексту явно не впливає інше), що знаходиться між верхнім і нижнім граничним значенням цього діапазону, і будь-яке інше встановлене або проміжне значення у зазначеному діапазоні входить в обсяг цього винаходу. Верхні і нижні граничні значення цих менших діапазонів можуть незалежно бути включені у менші діапазони і також входять в обсяг цього винаходу з урахуванням будь-якого спеціально виключеного граничного значення у визначеному діапазоні. Якщо визначений діапазон включає одне або обидва граничні значення, то діапазони, що виключають один або обидва ці включені граничні значення, також входять в обсяг цього винаходу. Деякі діапазони вказані в цьому винаході за допомогою числових значень, перед якими знаходиться термін "приблизно". Термін "приблизно" використовується у цьому винаході для забезпечення підтвердження точного значення, перед яким він знаходиться, а також значення, яке близьке до того, перед яким він знаходиться, або приблизно дорівнює йому. Для визначення того, чи є значення близьким або приблизно рівним спеціально зазначеному значенню, вважається, що близьке або приблизно рівне значення може бути значенням, яке у контексті, в якому воно наведено, є в основному еквівалентним спеціально зазначеному значенню. Всі публікації, патенти і заявки на патенти, цитовані у цьому описі, включені у цей винахід як посилання таким чином, наче для кожної такої публікації, патенту або заявки на патент було спеціально і окремо зазначено, що вона включена в цей винахід як посилання. Крім того, кожна цитована публікація, патент або заявка на патент включена в цей винахід як посилання для розкриття і опису об'єкта, у зв'язку з яким процитовано публікації. Цитування будь-якої публікації наведено для її розкриття до дати подачі і його не слід розглядати як припущення того, що описаний винахід є попереднім рівнем техніки для цього винаходу. Крім того, наведені дати публікації можуть відрізнятися від реальних дат публікації, і може знадобитися їх незалежне підтвердження.

[0012] Слід зазначити, що пункти формули винаходу можуть бути змінені для виключення будь-якого необов'язкового елемента. Само по собі це твердження призначене для використання як передумова для використання такої виключаючої термінології, як "виключно", "тільки" і т. п. у зв'язку з перерахуванням елементів формули винаходу або використанням

"негативного" обмеження. Як повинні розуміти фахівці у цій галузі техніки після вивчення цього винаходу, кожен з окремих варіантів реалізації, описаних і проілюстрованих у цьому винаході, включає окремі компоненти і ознаки, які можна легко відокремити або об'єднати з ознаками будь-якого з інших різних варіантів реалізації без відхилення від обсягу або сутності винаходу.

Будь-який вказаний спосіб можна здійснити у зазначеному порядку дій або в будь-якому іншому порядку, який логічно можливий. Хоча будь-які способи і матеріали, які є аналогічними або еквівалентними описаним у цьому винаході, також можна використовувати при практичній реалізації або тестуванні цього винаходу, нижче описані типові ілюстративні способи і матеріали.

[0013] Наведені нижче визначення у широкому сенсі застосовуються у кожному з варіантів реалізації цього винаходу, наведених нижче у цьому винаході. Якщо не приведені інші визначення, то всі технічні та наукові терміни, що використовуються у цьому винаході, зазвичай володіють такими самими значеннями, як це розуміє фахівець із загальною підготовкою у галузі техніки, до якої належить цей винахід. Зазвичай номенклатура, що використовується у цьому винаході, і лабораторні методики аналітичної хімії та органічного синтезу, добре відомі і зазвичай використовуються у цій галузі техніки. Для хімічного синтезу і хімічного аналізу використовуються стандартні методики або їх модифікації.

[0014] Термін "алкіл", окремо або в якості частини іншого замісника, означає, якщо не вказано інше, радикал, що володіє лінійним або розгалуженим ланцюгом, або циклічний вуглеводневий радикал, або їх комбінацію, який є повністю насиченим і може включати моно-, ди-, три- і чотирихвалентні радикали, що містять зазначену кількість атомів вуглецю (т. ч. C₁-C₁₀ означає від 1 до 10 атомів вуглецю). Приклади насичених вуглеводневих радикалів включають, але не обмежуються тільки ними, такі групи, як метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, трет-бутил, ізобутил, втор-бутил, циклогексил, (циклогексил)метил, циклопропілметил, гомологи і ізомери, наприклад, н-пентил, н-гексил, н-гептил, н-октил і т. п. Термін "алкіл" при використанні у цьому винаході означає алкільні фрагменти, які можуть представляти собою моно-, ди- або багатовалентні частинки відповідно до вимог, що висуваються до валентності.

[0015] Термін "алкеніл", окремо або в якості частини іншого замісника, означає, якщо не вказано інше, алкільний радикал, який володіє лінійним або розгалуженим ланцюгом, або циклічний алкільний радикал, або їх комбінацію, який містить один або декілька подвійних вуглець-вуглецевих зв'язків. Приклади алкенільних груп включають, але не обмежуються тільки ними, вініл, 2-пропеніл, кротил, ізопентен-2-іл, бутадієн-2-іл, 2,4-пентадієніл, 1,4-пентадієн-3-іл і вищі гомологи та ізомери.

[0016] Термін "алкініл", окремо або в якості частини іншого замісника, означає, якщо не вказано інше, алкільний радикал, який володіє лінійним або розгалуженим ланцюгом, або циклічний алкільний радикал, або їх комбінацію, який містить один або декілька потрійних вуглець-вуглецевих зв'язків. Приклади алкінільних груп включають, але не обмежуються тільки ними, етініл, 1 і 3-пропініл, 3-бутініл і вищі гомологи та ізомери.

[0017] Термін "алкілен", окремо або як частина іншого замісника, означає двовалентний радикал, утворений з алкільного фрагмента, прикладом якого без накладення обмежень є –CH₂CH₂CH₂CH₂–. Зазвичай алкільна (або алкіленова) група містить від 1 до 24 атомів вуглецю і групи, що містять 10 або меншу кількість атомів вуглецю, є переважними в цьому винаході. Для алкіленових і гетероалкіленових місткових груп необов'язково, щоб орієнтація місткової групи визначалася напрямком, в якому зображена формула місткової групи. Наприклад, формула –C(O)₂R'– означає –C(O)₂R'– та, необов'язково, –R'C(O)₂–. "Нижчий алкіл" або "нижчий алкілен" є коротколанцюговою алкільною або алкіленовою групою, яка зазвичай містить 8, 7, 6, 5 або меншу кількість атомів вуглецю.

[0018] Терміни "алкоксигрупа", "алкіламіногрупа" і "алкілтіогрупа" (або тіоалкоксигрупа) використовують в їх звичайному розумінні і вони означають алкільні групи, приєднані до іншої частини молекули через атом кисню, аміногрупу або атом сірки відповідно.

[0019] Термін "гетероалкіл", окремо або в комбінації з іншим терміном, означає, якщо не вказано інше, алкільний радикал, який володіє лінійним або розгалуженим ланцюгом, або циклічний алкільний радикал, який містить вказану кількість атомів вуглецю і щонайменше один гетероатом, обраний з групи, що включає B, O, N, Si та S, де гетероатомом необов'язково може бути окислений і атом азоту необов'язково може бути кватернізований. Гетероатомом(и) може знаходитися в будь-якому внутрішньому положенні гетероалкільної групи або на кінці, наприклад, в положенні, через яке алкільна група приєднана до решти молекули. Приклади "гетероалкільних" груп включають, але не обмежуються лише ними, –CH₂–CH₂–O–CH₃, –CH₂–CH₂–NH–CH₃, –CH₂–CH₂–N(CH₃)–CH₃, –CH₂–S–CH₂–CH₃, –CH₂–CH₂–S(O)–CH₃, –CH₂–CH₂–S(O)₂–CH₃, –Si(CH₃)₃, та –CH₂–CH=N–OCH₃. Два або більша кількість гетероатомів можуть

розташовуватися один за одним, наприклад, $-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{OCH}_3$ та $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$. Аналогічним чином, термін "гетероалкілен" окремо або як частина іншого замісника означає двовалентний гетероалкільний радикал, прикладом якого без накладення обмежень є $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ та $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-$. У гетероалкіленових групах гетероатоми також можуть займати

одне або обидва кінцевих положень (наприклад, алкіленоксигрупа, алкілендіоксигрупа, алкіленаміногрупа, алкілендіаміногрупа і т. п.).

[0020] Терміни "циклоалкіл" і "гетероциклоалкіл", окремо або в комбінації з іншими термінами, означають, якщо не вказано інше, циклічні варіанти "алкілу" і "гетероалкілу" відповідно. Крім того, у гетероциклоалкілі гетероатом може займати положення, за допомогою якого гетероцикл приєднаний до іншої частини молекули. Приклади циклоалкілу включають, але не обмежуються тільки ними, циклопентил, циклогексил, циклогептил і т. п. Приклади гетероциклоалкілу включають, але не обмежуються тільки ними, 1-піперидин, 2-піперидин, 3-піперидин, 4-морфолініл, 3-морфолініл, тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл, тетрагідротієн-2-іл, тетрагідротієн-3-іл, 1-піперазиніл, 2-піперазиніл і т. п.

[0021] В деяких варіантах реалізації будь-яка з алкільних, алкенільних, алкінільних, алкіленових, гетероалкіленових, алкоксигруп, алкіламіногруп, алкілтіогруп, гетероалкільних, циклоалкільних і гетероциклоалкільних груп необов'язково заміщена, наприклад, однієї або великою кількістю груп, які в цьому винаході називаються "замісник алкільної групи".

[0022] Термін "галоген", окремо або як частина іншого замісника, означає, якщо не вказано інше, атом фтору, хлору, бром або йоду. Крім того, такі терміни, як "галогеналкіл", включають моногалогеналкіл і полігалогеналкіл. Наприклад, термін "галоген($\text{C}_1\text{-C}_4$)алкіл" включає, але не обмежується тільки ними, трифторметил, 2,2,2-трифторетил, 4-хлорбутил, 3-бромпропіл і т. п.

[0023] Термін "арил" означає, якщо не вказано інше, поліненасичений ароматичний замісник, який може представляти собою одне кільце або декілька кілець (переважно від 1 до 3 кілець), які сконденсовані один з одним. Термін "гетероарил" означає арильні групи (або кільця), які містять від 1 до 4 гетероатомів, обраних з групи, що включає N, O і S, де атоми азоту і сірки необов'язково окислені, і атом(и) азоту необов'язково кватернізовані. Гетероарильна група може бути приєднана до решти молекули через гетероатом. Необмежуючі приклади арильних і гетероарильних груп включають феніл, 1-нафтил, 2-нафтил, 1-піроліл, 2-піроліл, 3-піроліл, 3-піразоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, піразиніл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піридил, 3-піридил, 4-піридил, 2-піримідил, 4-піримідил, 5-бензотіазоліл, пуриніл, 2-бензімідазолу, 5-індол, 1-ізохіноліл, 5-ізохіноліл, 2-хіноксалініл, 5-хіноксалініл, 3-хіноліл і 6-хіноліл. У деяких варіантах реалізації будь-яка з арильних і гетероарильних груп необов'язково заміщена, наприклад, однією або великою кількістю груп, які в цьому винаході називаються як "замісник арильної групи".

[0024] Термін "арилалкіл" включає такі радикали, в яких арильна група приєднана до алкільної групи (наприклад, бензил, фенетил і т. п.).

[0025] Замісники для алкільних і гетероалкільних радикалів, а також групи, які часто називаються як алкілен, гетероалкілен, алкеніл, гетероалкеніл, алкініл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл, циклоалкеніл, і гетероциклоалкеніл, в цілому називають як "замісники алкільної групи", і вони можуть представляти собою одну або декілька з безлічі груп, обраних з групи, що включає, але не обмежуються тільки ними: $-\text{OR}'$, $=\text{O}$, $=\text{NR}'$, $=\text{N}-\text{OR}'$, $-\text{NR}'\text{R}$, $-\text{SR}'$, $-\text{галоген}$, $-\text{SiR}'\text{R}'\text{R}''$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{CO}_2\text{R}'$, $-\text{CONR}'\text{R}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}'\text{R}$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})_2\text{R}'$, $-\text{NR}-\text{C}(\text{NR}'\text{R}'\text{R}'')=\text{NR}'''$, $-\text{NR}-\text{C}(\text{NR}'\text{R})=\text{NR}'''$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}'$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}'\text{R}$, $-\text{NR}\text{SO}_2\text{R}'$, $-\text{CN}$ та $-\text{NO}_2$ в кількості, що знаходиться в діапазоні від 0 до $(2m'+1)$, де m' означає повну кількість атомів вуглецю у такому радикалі. R' , R , R'' та R''' всі переважно незалежно означають водень, заміщений або незаміщений гетероалкіл, заміщений або незаміщений арил, наприклад, арил, заміщений за допомогою 1-3 галогенів, заміщений або незаміщений алкіл, алкоксигрупу або тіоалкоксигрупу, або арилалкільні групи. Якщо сполука, запропонована в цьому винаході, включає більше однієї групи R, наприклад, кожна з груп R незалежно обрана як кожна група R' , R , R'' та R''' , коли міститься більше ніж одна з цих груп. Якщо R' та R приєднані до одного атому азоту, вони можуть об'єднуватися з атомом азоту з утворенням 5-, 6- або 7-членного кільця. Наприклад, $-\text{NR}'\text{R}$ включає, але не обмежується тільки ними, 1-піролідініл і 4-морфолініл. З проведеного вище обговорення замісників фахівець в цій галузі техніки повинен розуміти, що термін "заміщений алкіл" включає групи з атомами вуглецю, пов'язаними з групами, які не є воднем, такі як галогеналкіл (наприклад, $-\text{CF}_3$ та $-\text{CH}_2\text{CF}_3$) та ацил (наприклад, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$ і т. п.).

[0026] Аналогічно замісникам, описаним для алкільного радикала, замісники для арильних і гетероарильних груп в цілому називаються "замісниками арильної групи". Типові замісники

обрані зі списку замісників алкільної групи і інші, наприклад: галоген, $-OR'$, $=O$, $=NR'$, $=N-OR'$, $-NR'R''$, $-SR'$, $-SiR'R''R'''$, $-OC(O)R'$, $-C(O)R'$, $-CO_2R'$, $-CONR'R''$, $-OC(O)NR'R''$, $-NR'C(O)R'$, $-NR'-C(O)NR'R'''$, $-NR'C(O)_2R'$, $-NR-C(NR'R'R''')=NR'''$, $-NR-C(NR'R'')=NR''$, $-S(O)R'$, $-S(O)_2R'$, $-S(O)_2NR'R''$, $-NRSO_2R'$, $-CN$ та $-NO_2$, $-R'$, $-N_3$, $-CH(Ph)_2$, фтор(C_1 - C_4)алкоксигрупа, та фтор(C_1 - C_4)алкіл, в кількості, що знаходиться в діапазоні від 0 до повної кількості вільних валентностей ароматичної кільцевої системи; і де R' , R'' , R''' та R'''' переважно незалежно обрані з групи, що включає водень, заміщений або незаміщений алкіл, заміщений або незаміщений гетероалкіл, заміщений або незаміщений арил і заміщений або незаміщений гетероарил. Якщо сполука, запропонована в цьому винаході, включає більше однієї групи R , наприклад, кожна з груп R незалежно обрана з числа груп R' , R'' , R''' та R'''' , коли міститься більше ніж одна з цих груп.

[0027] Два із замісників арильного або гетероарильного кільця разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково можуть бути пов'язані з утворенням кільця (наприклад, циклоалкільні або гетероциклоалкільного кільця), яке сконденсовано з утворенням арильного або гетероарильного кільця.

[0028] Два із замісників у сусідніх атомах арильного або гетероарильного кільця необов'язково можуть бути заміщені замісником формули $-T-C(O)-(CRR')_q-U-$, в якій T та U незалежно означають $-NR-$, $-O-$, $-CRR'-$ або одинарний зв'язок, і q є цілим числом, що дорівнює від 0 до 3. Альтернативно, два із замісників у сусідніх атомах арильного або гетероарильного кільця необов'язково можуть бути заміщені замісником формули $-A-(CH_2)_r-B-$, в якій A та B незалежно означають $-CRR'-$, $-O-$, $-NR-$, $-S-$, $-S(O)-$, $-S(O)_2-$, $-S(O)_2NR'-$ або одинарний зв'язок, і r є цілим числом, що дорівнює від 0 до 4. Один з ординарних зв'язків утвореного таким чином нового кільця необов'язково може бути замінений подвійним зв'язком. Альтернативно, два із замісників у сусідніх атомах арильного або гетероарильного кільця необов'язково можуть бути заміщені замісником формули $-(CRR')_s-X-(CR'R'')_d-$, в якій s і d незалежно означають цілі числа, що дорівнюють від 0 до 3, та X означає $-O-$, $-NR'-$, $-S-$, $-S(O)-$, $-S(O)_2-$, або $-S(O)_2NR'-$. Замісники R , R' , R'' та R''' переважно незалежно обрані з групи, що включає водень або заміщений або незаміщений (C_1 - C_{16})алкіл.

[0029] При використанні в цьому винаході термін "гетероатомом" включає кисень (O), азот (N), сірку (S) і кремній (Si).

[0030] Символ " R " є загальною аббревіатурою, яка позначає заміщуючу групу, яка обрана з групи, що включає H, заміщений або незаміщений алкіл, заміщений або незаміщений гетероалкіл, заміщений або незаміщений арил, заміщений або незаміщений гетероарил, і заміщений або незаміщений гетероциклічний групи. R також може означати замісників алкільної групи і замісників арильної групи.

[0031] Термін "сіль (солі)" включає солі сполук, які отримують з відносно нетоксичними кислотами або основами залежно від конкретних замісників, які знаходяться в сполуках, описаних в цьому винаході. Якщо сполуки, запропоновані в цьому винаході, містять відносно кислі функціональні групи, то солі приєднання з основами можна отримати шляхом взаємодії нейтральної форми таких сполук з достатньою кількістю бажаної основи, нерозбавленої або в потрібному інертному розчиннику. Приклади солей приєднання з основами включають сіль натрію, калію, кальцію, амонію, органічної аміногрупи, або сіль магнію, або аналогічну сіль. Якщо сполуки, запропоновані в цьому винаході, містять відносно лужні функціональні групи, то солі приєднання з кислотами можна отримати шляхом взаємодії нейтральної форми таких сполук з достатньою кількістю бажаної кислоти, нерозбавленої або в потрібному інертному розчиннику. Приклади солей приєднання з кислотами включають утворені з неорганічних кислот, таких як хлористоводнева, бромистоводнева, азотна, вугільна, моногідровугільна, фосфорна, моногідрофосфорна, дигідрофосфорна, сірчана, моногідросірчана, йодистоводнева або фосфорна кислоти і т. п., а також солі, утворені з відносно нетоксичних органічних кислот, таких як оцтова, пропіонова, ізомасляна, масляна, малеїнова, яблучна, малінова, бензойна, бурштинова, пробкова, фумарова, молочна, мигдальна, фталева, бензолсульфонова, п-толуолсульфонова, лимонна, винна, метансульфонова і т. п. В обсяг цього винаходу також входять солі амінокислот, такі як аргінат і т. п., і солі органічних кислот, такі як солі глюкуронової або галактуринової кислоти і т. п. [див., наприклад, публікацію Berge et al., Journal of Pharmaceutical Science, 66: 1-19 (1977)]. Деякі конкретні сполуки, запропоновані в цьому винаході, містять і основні, і кислі функціональні групи, що дозволяє перетворити сполуки в солі приєднання з основами або кислотами. В обсяг цього винаходу також входять гідрати солей.

[0032] Символ \sim , розташований перпендикулярно зв'язку, показує положення, в якому представлений фрагмент приєднаний до іншої частини молекули.

[0033] Сполуки, описані в цьому винаході, можуть містити один або більшу кількість асиметричних центрів або площин. Сполуки, запропоновані в цьому винаході, які містять

асиметрично заміщений атом, можна виділити в оптично активних або рацемічних формах. У цій галузі техніки добре відомо, як отримати оптично активні форми, наприклад, шляхом поділу рацемічних форм (рацематів), за допомогою асиметричного синтезу або за допомогою синтезу з оптично активних вихідних речовин. Поділ рацематів можна провести, наприклад, за допомогою звичайних методик, таких як кристалізація в присутності розподіляючого реагента або хроматографія з використанням, наприклад, хіральної колонки для високоефективної рідинної хроматографії. Багато геометричних ізомерів олефінів, подвійних зв'язків C=N і т. п. також можуть міститися в сполуках, описаних в цьому винаході, і всі такі стабільні ізомери входять в обсяг цього винаходу. Цис- і транс-геометричні ізомери сполук, запропонованих в цьому винаході, описані і можуть бути виділені у вигляді суміші ізомерів або у вигляді окремих ізомерних форм. Всі хіральні (енантіомерні і діастереоізомерні) і рацемічні форми, а також всі геометричні ізомерні форми структури входять в обсяг цього винаходу, якщо явно не вказана конкретна стереохімічна конфігурація або ізомерна форма.

[0034] Графічні зображення рацемічних, амбіскалемічних і скалемічних або енантіомерно чистих сполук, що використовуються у цьому винаході, взяті з публікацій Maehr, J. Chem. Ed., 62: 114-120 (1985): суцільні і пунктирні клиноподібні зв'язки використовують для позначення абсолютної конфігурації хірального елемента; хвилясті лінії вказують заперечення будь-якого стереохімічного значення, яке може означати зв'язок, який його позначає; суцільні і пунктирні лінії зв'язку є геометричними позначеннями, що вказують на відносну конфігурацію, але не означають абсолютну стереохімічну конфігурацію; і клиноподібні контури і пунктирні або лінії у вигляді штрихів позначають енантіомерно чисті сполуки невизначеної абсолютної конфігурації.

[0035] Термін "заряджена група" означає групу, яка володіє негативним зарядом або позитивним зарядом. Негативний заряд або позитивний заряд може володіти зарядовим числом, яке є цілим числом, обраним із групи, що включає 1, 2, 3 або більше або має дробове значення. Типові заряджені групи включають наприклад, $-\text{OPO}_3^{2-}$, $-\text{OPO}_2^-$, $-\text{P}^+\text{Ph}_3$, $-\text{N}^+\text{R}'\text{R}''\text{R}'''$, $-\text{S}^+\text{R}$ та $-\text{C}(\text{O})\text{O}^-$. Слід розуміти, що заряджені групи супроводжуються протиіонами протилежного заряду, незалежно від того, чи вказані явно такі протиіони в формулах, наведених у цьому винаході.

[0036] Сполуки, описані в цьому винаході, можуть містити одну або більшу кількість заряджених груп. Наприклад, сполуки можуть бути цвіттеріонними, але можуть бути в цілому нейтральними. Інші варіанти реалізації можуть містити одну або більшу кількість заряджених груп в залежності від pH і інших факторів. У цих варіантах реалізації сполука може бути асоційована з відповідним протиіоном. У цій галузі техніки добре відомо, як отримати солі або замінити протиіони. Зазвичай такі солі можна отримати за реакцією сполук в формах вільних кислот зі стехіометричною кількістю відповідної основи (такої як гідроксид, карбонат, бікарбонат і т. п. Na, Ca, Mg або K) або за реакцією цих сполук в формах вільних основ зі стехіометричною кількістю підходящої кислоти. Такі реакції зазвичай проводять у воді або в органічному розчиннику, або в суміші цих двох. Протиіони можна замінювати, наприклад, за допомогою методик іонного обміну, таких як іонообмінна хроматографія. В обсяг цього винаходу входять всі цвіттеріони, солі і протиіони, якщо протиіон або сіль явно не вказані.

[0037] У деяких варіантах реалізації визначення термінів, що використовуються у цьому винаході, відповідають IUPAC.

[0038] У цьому винаході "регулювання або покращення росту рослин" означає покращення міцності рослини, покращення якості рослини, покращення стійкості до стресових факторів та/або покращену ефективність використання запропонованого засобу.

[0039] "Покращення міцності рослини" означає, що деякі характеристики покращені якісно або кількісно у порівнянні з такою ж характеристикою контрольної рослини, що росте за таких самих умов без застосування способу, що пропонується в цьому винаході. Такі характеристики включають, але не обмежуються тільки ними, більш раннє та/або покращене проростання, покращену схожість, можливість використання меншої кількості насіння, посилений ріст коренів, більш розвинену кореневу систему, збільшену кількість кореневих бульбочок, посилення росту надземної частини рослини, посилення пагоноутворення, утворення більш сильних пагонів, утворення більш продуктивних пагонів, посилення або покращення густоти стояння рослин, менше вилягання рослин, збільшення та/або покращення висоти рослини, збільшення маси рослини (у свіжому або сухому вигляді), збільшення пластинок листя, більш зелений колір листя, збільшений вміст пігменту, збільшену фотосинтетичну активність, більш раннє цвітіння, довші волоті, більш раннє дозрівання зерна, збільшений розмір насіння, плодів або стручків, збільшену кількість стручків або колосків, збільшену кількість насіння у стручку або колоску, збільшену масу насінини, більш наліті насінини, меншу кількість опалого нижнього листя, затримку в'янення, покращену життєздатність рослини, збільшення вмісту амінокислот в

паренхімі та/або потреби в меншій кількості засобів, що використовуються (наприклад, потреба в меншій кількості добрива, води та/або обсязі робіт). Рослина з покращеною міцністю може характеризуватися покращенням будь-якої із зазначених вище характеристик або будь-якої комбінації або двох або більшої кількості зазначених вище характеристик.

[0040] "Покращення якості рослини" означає, що деякі характеристики покращені якісно або кількісно у порівнянні з такою ж характеристикою контрольної рослини, що росте за таких самих умов без застосування способу, що пропонується в цьому винаході. Такі характеристики включають, але не обмежуються тільки ними, покращений зовнішній вигляд рослини, зменшену кількість етилену (зменшене вироблення та/або інгібування засвоєння), покращену якість зібраного врожаю, наприклад, насіння, плодів, листя, овочів (така покращена якість може проявлятися у вигляді покращеного зовнішнього вигляду зібраного врожаю), збільшений вміст вуглеводів (наприклад, збільшення кількості цукру та/або крохмалю, покращене відношення цукор: кислота, зменшення вмісту цукру, що відновлюється, підвищений ступінь утворення цукру), збільшений вміст білка, збільшений вміст і покращений склад олії, збільшену поживну цінність, зменшений вміст антиживильних сполук, покращені органолептичні характеристики (наприклад, покращений смак) та/або покращений сприятливий вплив на здоров'я споживача (наприклад, збільшення вмісту вітамінів і антиоксидантів)), покращені післяжнивні характеристики (наприклад, збільшені термін зберігання та/або стабільність при зберіганні, легша переробка, легша екстракція сполук), більш рівномірний розвиток сільськогосподарської культури (наприклад, синхронізоване проростання, цвітіння та/або плодоношення рослин), та/або покращену якість насіння (наприклад, для використання в наступних сезонах). Рослина з покращеною якістю може характеризуватися покращенням будь-якої із зазначених вище характеристик або будь-якої комбінації або двох або більшої кількості зазначених вище характеристик.

[0041] "Покращення стійкості рослини до стресових факторів" означає, що деякі характеристики покращені якісно або кількісно у порівнянні з такою самою характеристикою контрольної рослини, що росте за таких самих умов без застосування способу, що пропонується в цьому винаході. Такі характеристики включають, але не обмежуються лише ними, збільшену стійкість та/або витривалість по відношенню до абіотичних стресових факторів, які призводять до гірших, ніж оптимальні, умов зростання, таким як посуха (наприклад, будь-який стрес, який призводить до недостатнього вмісту води в рослинах, до недостатнього потенціалу споживання води або зменшення подачі води до рослин), вплив холоду, вплив тепла, осмотичний стрес, стрес, викликаний УФ-випромінюванням, затоплення, підвищену солоність (наприклад, в ґрунті), збільшений вплив мінеральних речовин, вплив озону, сильний вплив світла та/або обмежену доступність поживних речовин (наприклад, азотних та/або фосфорних добрив). Рослина з покращеною стійкістю до стресових факторів може характеризуватися покращенням будь-якої із зазначених вище характеристик або будь-якої комбінації або двох або більшої кількості зазначених вище характеристик. У випадку стресу, викликаного посухою, і поживного стресу така покращена стійкість може бути обумовлена, наприклад, більш ефективним споживанням, використанням або утриманням води і поживних речовин. Зокрема, сполуки або композиції, запропоновані в цьому винаході, можна застосовувати для покращення стійкості до стресу, викликаного посухою.

[0042] "Покращена ефективність використання запропонованого засобу" означає, що рослини здатні рости більш ефективно з використанням цих кількостей запропонованих засобів, в порівнянні із зростанням контрольних рослин, які ростуть за тих самих умов без застосування способу, що пропонується в цьому винаході. Зокрема, запропоновані засоби включають, але не обмежуються тільки ними добриво (таке як азотне, фосфорне, калійне, поживні мікроелементи), світло та воду. Рослина з покращеною ефективністю використання запропонованого засобу може характеризуватися покращенням використання будь-якого із зазначених вище запропонованих засобів або будь-якої комбінації двох або більшої кількості зазначених вище запропонованих засобів.

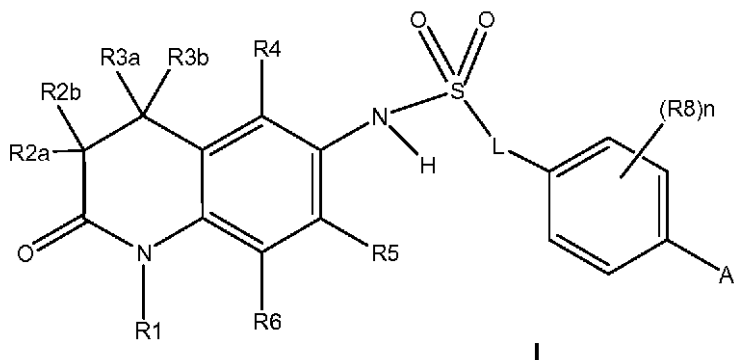
[0043] Термін "рослина" означає всі фізичні частини рослини, включаючи насіння, розсаду, пагони, коріння, бульби, стебла, живці, листя та плоди.

[0044] Термін "ділянка" при використанні в цьому винаході означає поля, в яких або на яких ростуть рослини, або на яких висіяне насіння оброблюваних рослин, або на яких насіння поміщено в ґрунт. Він включає ґрунт, насіння і розсаду, а також вкорінену рослинність.

[0045] Термін "матеріал для розмноження рослин" означає всі генеративні частини рослини, наприклад, насіння або вегетативні частини рослин, такі як живці і бульби. Він включає насіння у строгому сенсі слова, а також коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища і частини рослин.

Сполуки

[0046] Одним об'єктом цього винаходу є сполука формули (I):



або її солі або N-оксиди. R1, R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5, R6, L, A, R8 та n є такими, як визначено в цьому винаході. Будь-яка комбінація R1, R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5, R6, L, A, R8 та n явно входить в обсяг цього винаходу.

[0047] У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає водень, алкіл, ціаноалкіл, галогеналкіл, алкоксалкіл, галогеналкоксалкіл, циклоалкілалкіл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл і гетероциклоалкіл. У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл та C₄-C₅-гетероциклоалкіл. У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл. У деяких варіантах реалізації R1 означає C₁-C₆-алкіл. У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає алкіларил, циклоалкіл, феніл і гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 (тобто 1, 2 або 3) Rx. Rx є таким, як визначено в цьому винаході. У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл і 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx. У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx.

[0048] Переважно, якщо R1 обраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл.

[0049] Більш переважно, якщо R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл. Більш переважно, якщо R1 означає C₁-C₆-алкіл. У деяких варіантах реалізації алкільна група є лінійною або розгалуженою. У деяких варіантах реалізації R1 означає метил. У деяких варіантах реалізації R1 означає етил. У деяких варіантах реалізації R1 означає н-пропіл або ізопропіл. У деяких варіантах реалізації R1 означає н-бутил, ізобутил, втор-бутил або трет-бутил. У деяких варіантах реалізації R1 означає аліл. У деяких варіантах реалізації R1 означає пропаргіл.

[0050] У деяких варіантах реалізації R1 обраний з групи, що включає водень, метил, етил, н-пропіл, циклопропіл, аліл (-CH₂-CH=CH₂) та проп-2-ін-1-іл (-CH₂-C≡CH).

[0051] У деяких варіантах реалізації кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл і циклоалкіл. У деяких варіантах реалізації кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл. У деяких варіантах реалізації кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл.

[0052] Переважно, якщо кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл. Більш переважно, якщо кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, C₁-C₂-алкіл, C₁-C₂-галогеналкіл та C₁-C₂-алкоксигрупу.

[0053] У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, галогеналкіл, галогеналкоксигрупу і циклоалкіл. У деяких варіантах реалізації R2a і R2b, або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням циклоалкілу. У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл. У деяких варіантах реалізації R2a і R2b, або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням C₃-C₄-циклоалкілу. У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R3b, R4 і R5 всі означають водень. У деяких варіантах реалізації R6 обраний з групи, що включає водень і C₁-C₄-алкіл. У деяких варіантах реалізації щонайменше один з R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 не означає водень.

[0054] Переважно, якщо R2a, R2b, R3a і R3b всі незалежно обрані з групи, що включає водень, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, галоген і ціаногрупу. Більш переважно, якщо R2a, R2b, R3a і R3b незалежно означають метил або водень. В одному варіанті реалізації R3b означає метил. В іншому варіанті реалізації R2a, R2b і R3a означають водень і R3b означає метил.

[0055] Переважно, якщо R4, R5 і R6 всі незалежно обрані з групи, що включає водень, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, галоген та ціаногрупу. Більш переважно, якщо R4 і R5 всі означають водень. Більш переважно, якщо R6 обраний з групи, що включає водень, метил, етил, н-пропіл, фтор, хлор, бром і ціаногрупу. У деяких варіантах реалізації R6 означає водень. У деяких варіантах реалізації R6 означає метил. У деяких варіантах реалізації R6 означає етил. У деяких варіантах реалізації R6 означає н-пропіл. У деяких варіантах реалізації R6 означає фтор. У деяких варіантах реалізації R6 означає хлор. У деяких варіантах реалізації R6 означає бром. У деяких варіантах реалізації R6 означає ціаногрупу.

[0056] У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 всі означають водень. В іншому варіанті реалізації щонайменше один з R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 не означає водень. В одному варіанті реалізації щонайменше один з R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 означає метил.

[0057] У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R4 і R5 всі означають H. У деяких варіантах реалізації R3b обраний з групи, що включає водень і метил. У деяких варіантах реалізації R6 обраний з групи, що включає водень, метил, етил, н-пропіл, фтор, хлор і бром. У деяких варіантах реалізації R2a, R2b, R3a, R4 і R5 всі означають H; R3b обраний з групи, що включає водень і метил; і R6 обраний з групи, що включає водень, метил, етил, н-пропіл, фтор, хлор і бром.

[0058] У деяких варіантах реалізації L обраний з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкоксигрупу і алкоксіалкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 (тобто 1, 2 або 3) фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл і алкоксигрупу. У деяких варіантах реалізації L обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу. У деяких варіантах реалізації L означає C₁-C₂-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл. У деяких варіантах реалізації L означає C₁-C₂-алкіл.

[0059] Переважно, якщо L означає C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл. Більш переважно, якщо L означає C₁-C₂-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома галогенами, ціаногрупою або C₁-C₂-алкілом. У деяких варіантах реалізації L означає CH₂. У деяких варіантах реалізації L означає -CH₂CH₂-.

[0060] У деяких варіантах реалізації A означає циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 (тобто 1, 2, 3 або 4) R_y. R_y є таким, як визначено в цьому винаході. У деяких варіантах реалізації A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 R_y. У деяких варіантах реалізації A означає циклопропіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 (тобто 1, 2, 3 або 4) фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₂-алкіл і C₁-C₂-галогеналкіл.

[0061] Переважно, якщо A означає 3- або 4-членний циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 2 R_y. Більш переважно, якщо A означає циклопропіл.

[0062] У деяких варіантах реалізації кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, алкіл, галогеналкіл, -OH, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу,

алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR_{9a}R₉ та NHCOR₉. R₉ і R_{9a} є такими, як визначено в цьому винаході. У деяких варіантах реалізації, в яких один або більшу кількість R_y означають =O, =N-OH або -N=OMe, А не означає С₃-циклоалкіл. У деяких варіантах реалізації кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, -ОН, С₁-С₄-алкоксигрупу, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкілсульфаніл, С₁-С₄-галогеналкілсульфаніл, С₁-С₄-алкілсульфініл, С₁-С₄-галогеналкілсульфініл, С₁-С₄-алкілсульфоніл, С₁-С₄-галогеналкілсульфоніл, С₃-С₄-циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR_{9a}R₉ та NHCOR₉. У деяких варіантах реалізації кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, С₁-С₄-алкіл, -ОН, С₁-С₄-алкоксигрупу та С₁-С₄-галогеналкіл.

[0063] Переважно, якщо кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, С₁-С₄-алкіл, -ОН, С₁-С₄-алкоксигрупу та С₁-С₄-галогеналкіл. Більш переважно, якщо кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, метил, етил, метоксигрупу, етоксигрупу і трифторметил.

[0064] У деяких варіантах реалізації R₉ і R_{9a} незалежно означають алкіл. У деяких варіантах реалізації R₉ і R_{9a} незалежно означають С₁-С₄-алкіл.

[0065] У деяких варіантах реалізації кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл, циклоалкіл і алкоксіалкіл. У деяких варіантах реалізації кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-алкоксигрупу, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкілсульфаніл, С₁-С₄-галогеналкілсульфаніл, С₁-С₄-алкілсульфініл, С₁-С₄-галогеналкілсульфініл, С₁-С₄-алкілсульфоніл, С₁-С₄-галогеналкілсульфоніл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галогеналкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₂-С₆-галогеналкініл, С₃-С₆-циклоалкіл та С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл. У деяких варіантах реалізації кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген і С₁-С₄-алкіл.

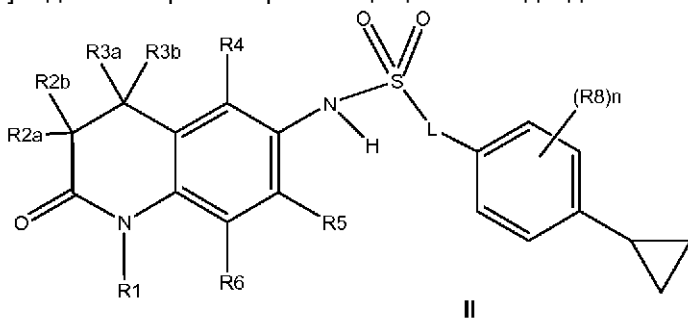
[0066] Переважно, якщо кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, і С₁-С₄-алкіл. Більш переважно, якщо кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень і галоген. У деяких варіантах реалізації R₈ означає фтор. У деяких варіантах реалізації R₈ означає хлор. У деяких варіантах реалізації R₈ означає бром.

[0067] У деяких варіантах реалізації кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, фтор, хлор, метил і етил.

[0068] У деяких варіантах реалізації n обраний з групи, що включає 1, 2 і 3. У деяких варіантах реалізації n обраний з групи, що включає 1 і 2.

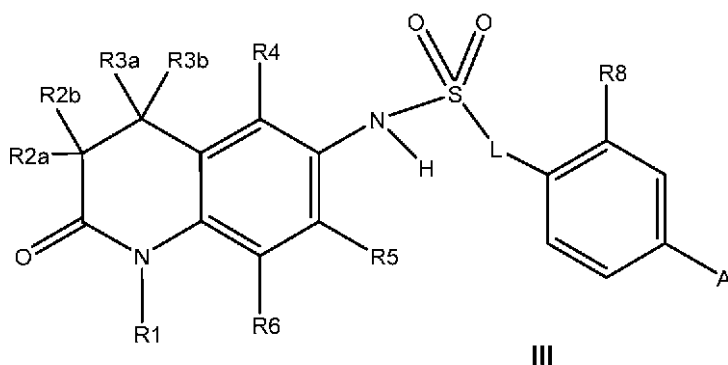
[0069] Переважно, якщо n дорівнює від 1 до 2 (тобто 1 або 2). У деяких варіантах реалізації n дорівнює 1. У деяких варіантах реалізації n дорівнює 2.

[0070] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (II):



в якій R₁, R_{2a}, R_{2b}, R_{3a}, R_{3b}, R₄, R₅, R₆, L, R₈ та n є такими, як визначено в цьому винаході.

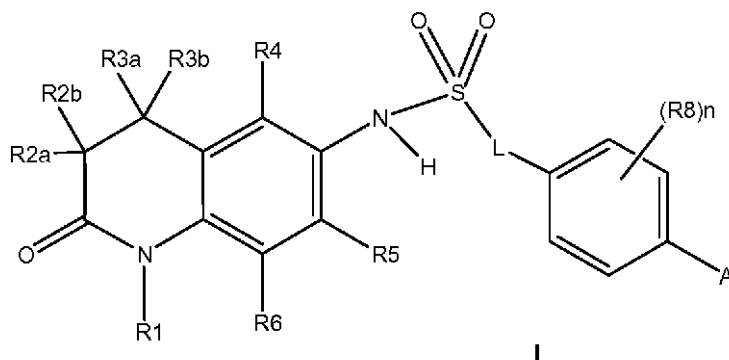
[0071] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (III):



в якій R1, R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5, R6, L, A та R8 є такими, як визначено в цьому винаході.

[0072] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки структури 1.xxx, 2.xxx, 3.xxx, 4.xxx, 5.xxx, 6.xxx, 7.xxx, 8.xxx або 9.xxx (див. таблицю 1), в якій R1, R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5, R6, L та R8 є такими, як визначено в цьому винаході.

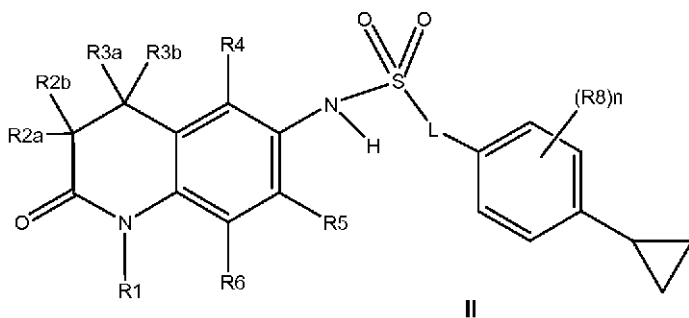
[0073] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (I):



в якій R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл та C₄-C₅-гетероциклоалкіл; R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx. кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл; R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 та R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; R2a і R2b, або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням C₃-C₄-циклоалкілу; L обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу. A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 Ry; кожен Ry незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, -OH, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₄-циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR₉aR₉ та NHCOR₉, за умови, що, якщо один або більша кількість Ry означають =O, =N-OH або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл; R₉ та R₉a незалежно означають C₁-C₄-алкіл; кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₆-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл; n обраний з групи, що включає 1, 2 та 3; або її солям чи N-оксидам.

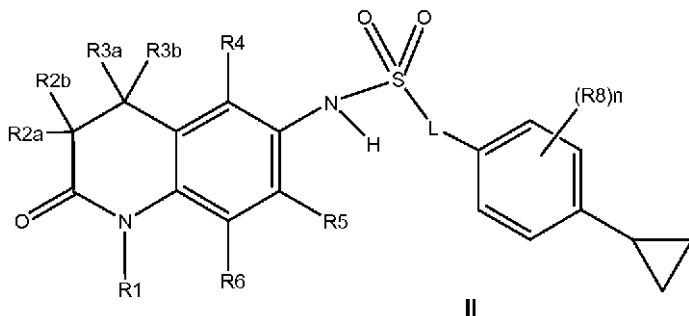
[0073] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (I), в якій R1 обраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл; R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 та R6 всі незалежно обрані з групи, що включає водень, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, галоген та ціаногрупу; L означає C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл; A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 Ry; кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; кожен Ry незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, -OH, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₄-галогеналкіл; кожен R8 незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген і C₁-C₄-алкіл; та n дорівнює від 1 до 2.

[0075] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (II):



в якій R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₅-циклоалкіл-C₁-C₄-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл та C₄-C₅-гетероциклоалкіл; R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу; L означає C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл; кожен R8 незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₅-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл; n дорівнює від 1 до 3; кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл; або її солям чи N-оксидам.

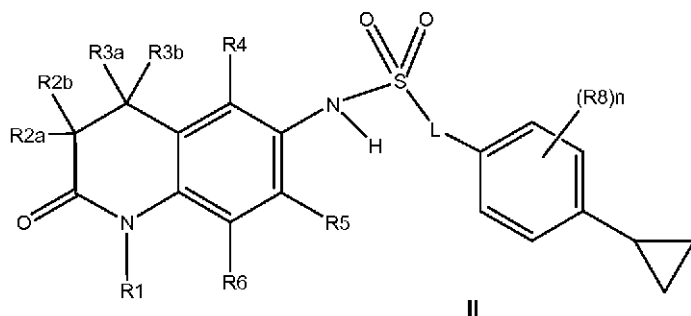
[0076] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (II):



в якій R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₅-циклоалкіл-C₁-C₄-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл

та C₄-C₅-гетероциклоалкіл; R_{2a}, R_{2b}, R_{3a}, R_{3b}, R₄, R₅ та R₆ незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу; L означає C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл; кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₆-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл; n равно от 1 до 3; кожен R_x незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; або її солям чи N-оксидам.

[0077] У деяких варіантах реалізації цей винахід відноситься до сполуки формули (II):



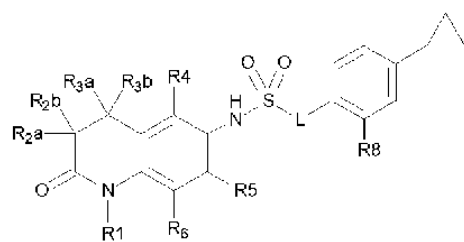
II

в якій R₁ обраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 R_x; або R₁ обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл; R_{2a}, R_{2b}, R_{3a}, R_{3b}, R₄, R₅ і R₆ незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу; L означає C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл; кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген і C₁-C₄-алкіл; n дорівнює від 1 до 3; кожен R_x незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; або її солям чи N-оксидам.

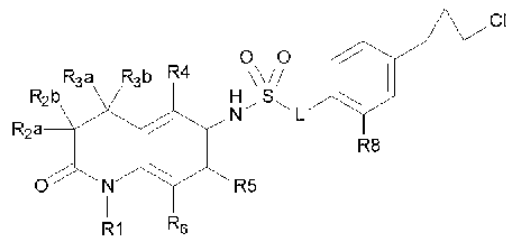
[0078] Наведена нижче таблиця 1 включає приклади сполук, запропонованих в цьому винаході.

ТАБЛИЦЯ 1

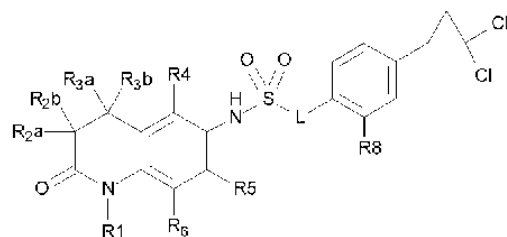
Кожну з наведених нижче структур можна об'єднати з комбінаціями замісників, наведеними в представленій нижче таблиці, так що конкретна сполука 1.001 представляє собою структуру 1.xxx, об'єднану зі сполукою x.001, конкретна сполука 5.123 представляє собою структуру 5.xxx, об'єднану зі сполукою x.123 в таблиці і т. д.



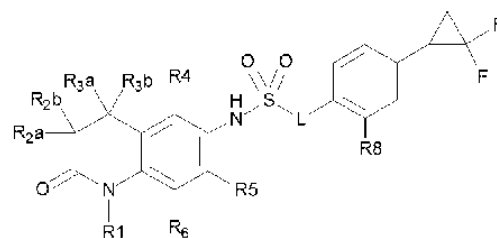
1.xxx



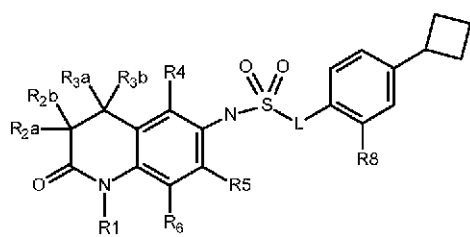
2.xxx



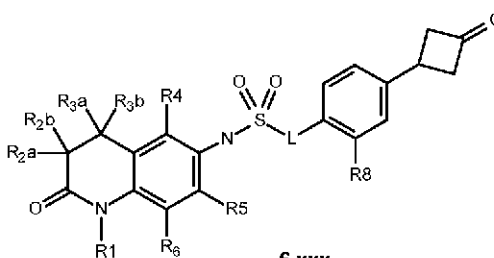
3.xxx



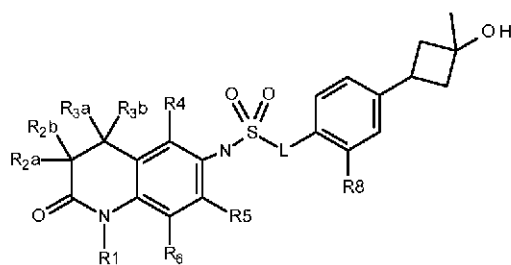
4.xxx



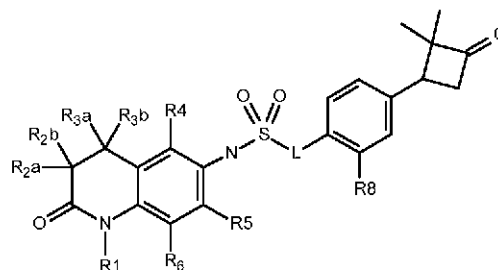
5.xxx



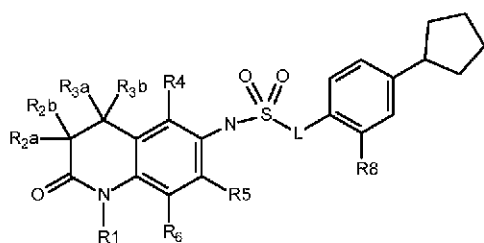
6.xxx



7.xxx



8.xxx



9.xxx

У наведеній нижче таблиці R2a, R2b, R3a, R4 і R5 всі означають H.

Сполука	R1	R6	R8	L	R3b
x.001	H	H	H	CH ₂	H
x.002	Me	H	H	CH ₂	H
x.003	Et	H	H	CH ₂	H
x.004	n-Pr	H	H	CH ₂	H
x.005	c-Pr	H	H	CH ₂	H
x.006	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	CH ₂	H
x.007	CH ₂ CCH	H	H	CH ₂	H
x.008	H	Me	H	CH ₂	H
x.009	Me	Me	H	CH ₂	H
x.010	Et	Me	H	CH ₂	H
x.011	n-Pr	Me	H	CH ₂	H
x.012	c-Pr	Me	H	CH ₂	H
x.013	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	CH ₂	H
x.014	CH ₂ CCH	Me	H	CH ₂	H
x.015	H	Et	H	CH ₂	H
x.016	Me	Et	H	CH ₂	H
x.017	Et	Et	H	CH ₂	H
x.018	n-Pr	Et	H	CH ₂	H
x.019	c-Pr	Et	H	CH ₂	H
x.020	CH ₂ CH=CH ₂	Et	H	CH ₂	H
x.021	CH ₂ CCH	Et	H	CH ₂	H
x.022	H	Cl	H	CH ₂	H
x.023	Me	Cl	H	CH ₂	H
x.024	Et	Cl	H	CH ₂	H
x.025	n-Pr	Cl	H	CH ₂	H
x.026	c-Pr	Cl	H	CH ₂	H
x.027	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	CH ₂	H
x.028	CH ₂ CCH	Cl	H	CH ₂	H
x.029	H	Br	H	CH ₂	H
x.030	Me	Br	H	CH ₂	H
x.031	Et	Br	H	CH ₂	H
x.032	n-Pr	Br	H	CH ₂	H
x.033	c-Pr	Br	H	CH ₂	H
x.034	CH ₂ CH=CH ₂	Br	H	CH ₂	H
x.035	CH ₂ CCH	Br	H	CH ₂	H
x.036	H	H	F	CH ₂	H
x.037	Me	H	F	CH ₂	H
x.038	Et	H	F	CH ₂	H
x.039	n-Pr	H	F	CH ₂	H
x.040	c-Pr	H	F	CH ₂	H
x.041	CH ₂ CH=CH ₂	H	F	CH ₂	H
x.042	CH ₂ CCH	H	F	CH ₂	H
x.043	H	Me	F	CH ₂	H
x.044	Me	Me	F	CH ₂	H
x.045	Et	Me	F	CH ₂	H
x.046	n-Pr	Me	F	CH ₂	H
x.047	c-Pr	Me	F	CH ₂	H
x.048	CH ₂ CH=CH ₂	Me	F	CH ₂	H
x.049	CH ₂ CCH	Me	F	CH ₂	H
x.050	H	Et	F	CH ₂	H
x.051	Me	Et	F	CH ₂	H
x.052	Et	Et	F	CH ₂	H
x.053	n-Pr	Et	F	CH ₂	H
x.054	c-Pr	Et	F	CH ₂	H
x.055	CH ₂ CH=CH ₂	Et	F	CH ₂	H
x.056	CH ₂ CCH	Et	F	CH ₂	H

x.057	H	Cl	F	CH ₂	H
x.058	Me	Cl	F	CH ₂	H
x.059	Et	Cl	F	CH ₂	H
x.060	n-Pr	Cl	F	CH ₂	H
x.061	c-Pr	Cl	F	CH ₂	H
x.062	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	F	CH ₂	H
x.063	CH ₂ CCH	Cl	F	CH ₂	H
x.064	H	Br	F	CH ₂	H
x.065	Me	Br	F	CH ₂	H
x.066	Et	Br	F	CH ₂	H
x.067	n-Pr	Br	F	CH ₂	H
x.068	c-Pr	Br	F	CH ₂	H
x.069	CH ₂ CH=CH ₂	Br	F	CH ₂	H
x.070	CH ₂ CCH	Br	F	CH ₂	H
x.071	H	H	Cl	CH ₂	H
x.072	Me	H	Cl	CH ₂	H
x.073	Et	H	Cl	CH ₂	H
x.074	n-Pr	H	Cl	CH ₂	H
x.075	c-Pr	H	Cl	CH ₂	H
x.076	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	CH ₂	H
x.077	CH ₂ CCH	H	Cl	CH ₂	H
x.078	H	Me	Cl	CH ₂	H
x.079	Me	Me	Cl	CH ₂	H
x.080	Et	Me	Cl	CH ₂	H
x.081	n-Pr	Me	Cl	CH ₂	H
x.082	c-Pr	Me	Cl	CH ₂	H
x.083	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Cl	CH ₂	H
x.084	CH ₂ CCH	Me	Cl	CH ₂	H
x.085	H	Et	Cl	CH ₂	H
x.086	Me	Et	Cl	CH ₂	H
x.087	Et	Et	Cl	CH ₂	H
x.088	n-Pr	Et	Cl	CH ₂	H
x.089	c-Pr	Et	Cl	CH ₂	H
x.090	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Cl	CH ₂	H
x.091	CH ₂ CCH	Et	Cl	CH ₂	H
x.092	H	Cl	Cl	CH ₂	H
x.093	Me	Cl	Cl	CH ₂	H
x.094	Et	Cl	Cl	CH ₂	H
x.095	n-Pr	Cl	Cl	CH ₂	H
x.096	c-Pr	Cl	Cl	CH ₂	H
x.097	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Cl	CH ₂	H
x.098	CH ₂ CCH	Cl	Cl	CH ₂	H
x.099	H	Br	Cl	CH ₂	H
x.100	Me	Br	Cl	CH ₂	H
x.101	Et	Br	Cl	CH ₂	H
x.102	n-Pr	Br	Cl	CH ₂	H
x.103	c-Pr	Br	Cl	CH ₂	H
x.104	CH ₂ CH=CH ₂	Br	Cl	CH ₂	H
x.105	CH ₂ CCH	Br	Cl	CH ₂	H
x.106	H	H	Me	CH ₂	H
x.107	Me	H	Me	CH ₂	H
x.108	Et	H	Me	CH ₂	H
x.109	n-Pr	H	Me	CH ₂	H
x.110	c-Pr	H	Me	CH ₂	H
x.111	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	CH ₂	H
x.112	CH ₂ CCH	H	Me	CH ₂	H
x.113	H	Me	Me	CH ₂	H
x.114	Me	Me	Me	CH ₂	H

x.115	Et	Me	Me	CH ₂	H
x.116	n-Pr	Me	Me	CH ₂	H
x.117	c-Pr	Me	Me	CH ₂	H
x.118	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	CH ₂	H
x.119	CH ₂ CCH	Me	Me	CH ₂	H
x.120	H	Et	Me	CH ₂	H
x.121	Me	Et	Me	CH ₂	H
x.122	Et	Et	Me	CH ₂	H
x.123	n-Pr	Et	Me	CH ₂	H
x.124	c-Pr	Et	Me	CH ₂	H
x.125	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Me	CH ₂	H
x.126	CH ₂ CCH	Et	Me	CH ₂	H
x.127	H	Cl	Me	CH ₂	H
x.128	Me	Cl	Me	CH ₂	H
x.129	Et	Cl	Me	CH ₂	H
x.130	n-Pr	Cl	Me	CH ₂	H
x.131	c-Pr	Cl	Me	CH ₂	H
x.132	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me	CH ₂	H
x.133	CH ₂ CCH	Cl	Me	CH ₂	H
x.134	H	Br	Me	CH ₂	H
x.135	Me	Br	Me	CH ₂	H
x.136	Et	Br	Me	CH ₂	H
x.137	n-Pr	Br	Me	CH ₂	H
x.138	c-Pr	Br	Et	CH ₂	H
x.139	CH ₂ CH=CH ₂	Br	Me	CH ₂	H
x.140	CH ₂ CCH	Br	Et	CH ₂	H
x.141	H	H	Et	CH ₂	H
x.142	Me	H	Et	CH ₂	H
x.143	Et	H	Et	CH ₂	H
x.144	n-Pr	H	Et	CH ₂	H
x.145	c-Pr	H	Et	CH ₂	H
x.146	CH ₂ CH=CH ₂	H	Et	CH ₂	H
x.147	CH ₂ CCH	H	Et	CH ₂	H
x.148	H	Me	Et	CH ₂	H
x.149	Me	Me	Et	CH ₂	H
x.150	Et	Me	Et	CH ₂	H
x.151	n-Pr	Me	Et	CH ₂	H
x.152	c-Pr	Me	Et	CH ₂	H
x.153	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Et	CH ₂	H
x.154	CH ₂ CCH	Me	Et	CH ₂	H
x.155	H	Et	Et	CH ₂	H
x.156	Me	Et	Et	CH ₂	H
x.157	Et	Et	Et	CH ₂	H
x.158	n-Pr	Et	Et	CH ₂	H
x.159	c-Pr	Et	Et	CH ₂	H
x.160	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	CH ₂	H
x.161	CH ₂ CCH	Et	Et	CH ₂	H
x.162	H	Cl	Et	CH ₂	H
x.163	Me	Cl	Et	CH ₂	H
x.164	Et	Cl	Et	CH ₂	H
x.165	n-Pr	Cl	Et	CH ₂	H
x.166	c-Pr	Cl	Et	CH ₂	H
x.167	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Et	CH ₂	H
x.168	CH ₂ CCH	Cl	Et	CH ₂	H
x.169	H	Br	Et	CH ₂	H
x.170	Me	Br	Et	CH ₂	H
x.171	Et	Br	Et	CH ₂	H
x.172	n-Pr	Br	Et	CH ₂	H

x.173	c-Pr	Br	Et	CH ₂	H
x.174	CH ₂ CH=CH ₂	Br	Et	CH ₂	H
x.175	CH ₂ CCH	Br	Et	CH ₂	H
x.176	H	H	H	CH ₂	Me
x.177	Me	H	H	CH ₂	Me
x.178	Et	H	H	CH ₂	Me
x.179	n-Pr	H	H	CH ₂	Me
x.180	c-Pr	H	H	CH ₂	Me
x.181	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	CH ₂	Me
x.182	CH ₂ CCH	H	H	CH ₂	Me
x.183	H	Me	H	CH ₂	Me
x.184	Me	Me	H	CH ₂	Me
x.185	Et	Me	H	CH ₂	Me
x.186	n-Pr	Me	H	CH ₂	Me
x.187	c-Pr	Me	H	CH ₂	Me
x.188	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	CH ₂	Me
x.189	CH ₂ CCH	Me	H	CH ₂	Me
x.190	H	Et	H	CH ₂	Me
x.191	Me	Et	H	CH ₂	Me
x.192	Et	Et	H	CH ₂	Me
x.193	n-Pr	Et	H	CH ₂	Me
x.194	c-Pr	Et	H	CH ₂	Me
x.195	CH ₂ CH=CH ₂	Et	H	CH ₂	Me
x.196	CH ₂ CCH	Et	H	CH ₂	Me
x.197	H	Cl	H	CH ₂	Me
x.198	Me	Cl	H	CH ₂	Me
x.199	Et	Cl	H	CH ₂	Me
x.200	n-Pr	Cl	H	CH ₂	Me
x.201	c-Pr	Cl	H	CH ₂	Me
x.202	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	CH ₂	Me
x.203	CH ₂ CCH	Cl	H	CH ₂	Me
x.204	H	Br	H	CH ₂	Me
x.205	Me	Br	H	CH ₂	Me
x.206	Et	Br	H	CH ₂	Me
x.207	n-Pr	Br	H	CH ₂	Me
x.208	c-Pr	Br	H	CH ₂	Me
x.209	CH ₂ CH=CH ₂	Br	H	CH ₂	Me
x.210	CH ₂ CCH	Br	H	CH ₂	Me
x.211	H	F	H	CH ₂	H
x.212	Me	F	H	CH ₂	H
x.213	Et	F	H	CH ₂	H
x.214	n-Pr	F	H	CH ₂	H
x.215	c-Pr	F	H	CH ₂	H
x.216	CH ₂ CH=CH ₂	F	H	CH ₂	H
x.217	CH ₂ CCH	F	H	CH ₂	H
x.218	H	F	H	CH ₂	Me
x.219	Me	F	H	CH ₂	Me
x.220	Et	F	H	CH ₂	Me
x.221	n-Pr	F	H	CH ₂	Me
x.222	c-Pr	F	H	CH ₂	Me
x.223	CH ₂ CH=CH ₂	F	H	CH ₂	Me
x.224	CH ₂ CCH	F	H	CH ₂	Me
x.225	Me	n-Pr	H	CH ₂	H

Me=метил; Et=етил; n-Pr=н-пропіл; c-Pr=циклопропіл.

[0079] Типові сполуки, запропоновані в цьому винаході, також наведені в прикладах.

Композиції та застосування

[0080] В одному варіанті реалізації сполуки, запропоновані в цьому винаході, наносять в комбінації з сільськогосподарсько прийнятною допоміжною речовиною. Зокрема, цей винахід відноситься до композиції, яка містить сполуку, пропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Також можна відзначити агрохімічну композицію, що містить сполуки, запропонованої в цьому винаході.

[0081] Цей винахід відноситься до способу покращення стійкості рослини до абіотичного стресу, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки, композиції або суміші, запропонованої в цьому винаході.

[0082] Цей винахід відноситься до способу регулювання або покращення росту рослин, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки, композиції або суміші, запропоновані в цьому винаході. В одному варіанті реалізації ріст рослин регулюється або покращується, коли рослина піддається абіотичному стресу.

[0083] Цей винахід також відноситься до способу пригнічення проростання насіння рослини, що включає нанесення на насіння або ділянку, що містить насіння, сполуки, композиції або суміші, запропонованої в цьому винаході.

[0084] Цей винахід також відноситься до способу захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів, що включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки, композиції або суміші, запропонованої в цьому винаході.

[0085] Сполуки або композицію переважно наносять в кількості, достатній для забезпечення бажаної відповіді.

[0086] Інші наслідки регулювання або покращення росту сільськогосподарської культури включають зменшення висоти рослини або зменшення пагоноутворення, які є корисними для рослини або умов вирощування, коли бажана менша біомаса і менше пагоноутворення.

[0087] Будь-які або всі зазначені вище покращення сільськогосподарської культури можуть призвести до підвищення врожайності внаслідок покращення, наприклад, фізіології рослини, зростання і розвитку рослини та/або архітекtonіки рослини. У контексті цього винаходу "врожайність" включає, але не обмежується тільки ними, (i) збільшення утворення біомаси, врожайності зерен, вмісту крохмалю, вмісту олії та/або вмісту білка, які можуть бути обумовлені (a) збільшенням продукції самої рослини або (b) покращенням можливості збору рослинного матеріалу, (ii) покращенням складу зібраного матеріалу (наприклад, збільшення відношення цукор: кислота, покращений склад олії, збільшену поживну цінність, зменшений вміст антиживильних сполук, покращений сприятливий вплив на здоров'я споживача) та/або (iii) покращену/полегшену можливість збору сільськогосподарської культури, покращену засвоєність сільськогосподарської культури та/або покращену стабільність при зберіганні/термін зберігання. Покращення врожайності сільськогосподарської рослини означає, що, коли можливо кількісне визначення, врожайність відповідного рослинного продукту збільшується на вимірювану кількість у порівнянні з врожайністю того ж рослинного продукту, отриманого за тих самих умов, але без застосування способу, що пропонується в цьому винаході. У цьому винаході бажано, щоб врожайність збільшилася щонайменше на 0,5 %, ще краще - щонайменше на 1 %, ще краще - щонайменше на 2 %, ще краще - щонайменше на 4 %, ще краще - на 5 % або навіть більше.

[0088] Будь-які або всі зазначені вище покращення сільськогосподарської культури також можуть призвести до покращеного використання земельної ділянки, тобто земельна ділянка, яка раніше була недоступною або недостатньо оптимальною для вирощування, може стати доступною. Наприклад, рослини, які мають покращену здатність виживати в умовах посухи, можуть бути придатні для вирощування на ділянках з недостатньо оптимальною кількістю опадів, наприклад, можливо, на краю пустелі або навіть в самій пустелі.

[0089] В одному об'єкті цього винаходу покращення сільськогосподарської культури забезпечують практично за відсутності впливу шкідників та/або хвороб, та/або абіотичного стресу. В іншому об'єкті цього винаходу покращення міцності рослини, стійкості до стресу, якості та/або врожайності забезпечують практично за відсутності впливу шкідників та/або хвороб. Наприклад, з шкідниками та/або хворобами можна боротися шляхом обробки пестицидами, які вносять до або одночасно із застосуванням способу, пропонованого в цьому винаході. У ще одному об'єкті цього винаходу покращення міцності рослини, стійкості до стресу, якості та/або врожайності забезпечують за відсутності впливу шкідників та/або хвороб. В іншому

варіанті реалізації покращення міцності рослини, якості та/або врожайності забезпечують за відсутності або практично за відсутності абіотичного стресу.

[0090] Сполуки, запропоновані в цьому винаході, можна використовувати окремо, але зазвичай їх готують у вигляді композиції з використанням допоміжних речовин, таких як носії, розчинники та поверхнево-активні речовини (SFAs). Таким чином, цей винахід також відноситься до композиції, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції, яка містить в основному сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

[0091] Цей винахід також відноситься до композиції регулятора росту рослин, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції регулятора росту рослин, яка містить в основному сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції регулятора росту рослин, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

[0092] Цей винахід також відноситься до композиції для боротьби з абіотичним стресом рослин, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції для боротьби з абіотичним стресом рослин, яка містить в основному сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції для боротьби з абіотичним стресом рослин, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

[0093] Цей винахід також відноситься до композиції інгібітора проростання насіння, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції інгібітора проростання насіння, яка містить в основному сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину. Цей винахід також відноситься до композиції інгібітора проростання насіння, яка містить сполуку, запропоновану у цьому винаході, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

[0094] Композиція може бути у формі концентратів, які розводять перед використанням, хоча також можна приготувати готові до застосування композиції. Кінцеве розведення зазвичай здійснюють за допомогою води, але замість, або на додаток до води його можна здійснити, наприклад, рідкими добривами, поживними мікроелементами, біологічними мікроорганізмами, олією або розчинниками.

[0095] Композиції зазвичай містять від 0,1 до 99 мас. %, бажано від 0,1 до 95 мас. %, сполук, запропонованих у цьому винаході, і від 1 до 99,9 мас. % допоміжної речовини, яка переважно містить від 0 до 25 мас. % поверхнево-активної речовини.

[0096] Композиції можна обрати з цілого ряду типів препаратів, багато з яких описані в публікації Manual on Development i Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999. Вони включають порошки для обпилювання (DP), розчинні порошки (SP), розчинні в воді гранули (SG), диспергуючі в воді гранули (WG), порошки, що змочується (WP), гранули (GR) (з повільним або швидким вивільненням), розчинні концентрати (SL), рідини, що змішується з олією (OL), рідини надмалого об'єму (UL), емульгуючі концентрати (EC), диспергуючі концентрати (DC), емульсії (і олія-у-воді (EW), і вода-в-олії (EO)), мікроемульсії (ME), концентрати суспензії (SC), аерозолі, капсульовані суспензії (CS) і препарати для обробки насіння. Обраний тип препарату у будь-якому випадку буде залежати від конкретного призначення, а також фізичних, хімічних і біологічних характеристик сполуки, запропонованої в цьому винаході.

[0097] Порошок для обпилювання (DP) можна отримати шляхом змішування сполуки, запропонованої в цьому винаході, з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів (наприклад, природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, оксидом алюмінію, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, діатомовою землею, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію і магнію, сіркою, гідроксидом кальцію, різними типами борошна, тільком та іншими органічними та неорганічними твердими носіями) і механічного розмелювання суміші у тонкоподрібнений порошок.

[0098] Розчинні порошки (SP) можна отримати шляхом змішування сполуки, запропонованої в цьому винаході, з однієї або великою кількістю розчинних у воді неорганічних солей (таких як

бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) або одним або більшою кількістю розчинних у воді органічних твердих речовин (таких як полісахарид) і необов'язково одним або більшою кількістю змочуючих агентів, з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів або сумішшю таких агентів для покращення диспергованості/розчинності в воді. Потім суміш розмелюють в тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з отриманням розчинних у воді гранул (SG).

[0099] Порошки, що змочуються (WP), можна отримати шляхом змішування сполуки, запропонованої в цьому винаході, з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів або носіїв, з одним або більшою кількістю змочуючих агентів і переважно одним або більшою кількістю диспергуючих агентів і необов'язково з одним або більшою кількістю суспендуєчих агентів для полегшення диспергування в рідинах. Потім суміш розмелюють в тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з отриманням диспергуючих у воді гранул (WG).

[0100] Гранули (GR) можна отримати або шляхом гранулювання суміші сполуки, запропонованої в цьому винаході, з одним або більшою кількістю порошкоподібних твердих розріджувачів або носіїв, або з попередньо сформованих гранул, що не містять активного інгредієнта, шляхом абсорбції сполуки, запропонованої в цьому винаході (або її розчину в підходящому агенті) в пористому гранульованому матеріалі (такому як пемза, аттапульгітові глини, фуллерова земля, кізельгур, діатомова земля або розмелені кукурудзяні качани) або шляхом адсорбції сполуки, запропонованої в цьому винаході (або її розчину в підходящому агенті) в твердому наповнювачі (такому як пісок, силікати, неорганічні карбонати, сульфати або фосфати) з проведенням сушіння за необхідності. Агенти, які зазвичай застосовуються для сприяння абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні і ароматичні нафтові розчинники, спирти, прості ефіри, кетони і складні ефіри) і склеюючих агентів (таких як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри і рослинні олії). В гранули також можна включити одну або більшу кількість інших добавок (наприклад, емульгуючий агент, змочувальний агент або диспергуючий агент).

[0101] Диспергуючі концентрати (DC) можна отримати шляхом розчинення сполуки, запропонованої в цьому винаході, у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або простий ефір гліколю. Ці розчини можуть містити поверхнево-активну речовину (наприклад, для покращення розведення водою або запобігання кристалізації в баку для обприскування).

[0102] Емульгуючі концентрати (EC) або емульсії олія-у-воді (EW) можна отримати шляхом розчинення сполуки, запропонованої в цьому винаході, в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або більшу кількість змочуючих агентів, один або більшу кількість емульгуючих агентів або суміш таких агентів) Підходящі для використання в ECs органічні розчинники включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 і SOLVESSO 200; SOLVESSO є зареєстрованим товарним знаком), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон), спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід жирної кислоти C₈-C₁₀) і хлоровані вуглеводні. Готовий EC може мимоволі емульгуватися при додаванні до води з утворенням емульсії, яка володіє достатньою стабільністю, щоб за допомогою відповідного обладнання було можливе проведення обприскування.

[0103] Отримання EW включає отримання сполуки, запропонованої в цьому винаході, у вигляді рідини (якщо за кімнатної температури вона не є рідиною, то її можна розплавити за підходящої температури, звичайно нижче 70 °C) або розчину (шляхом розчинення у відповідному розчиннику) з подальшим емульгуванням отриманої рідини або розчину в воді, що містить один або декілька SFAs, при великому зсувному зусиллі, з отриманням емульсії. Підходящі для використання в EWs розчинники включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) та інші підходящі органічні розчинники, які мають низьку розчинність в воді.

[0104] Мікроемульсії (ME) можна отримати шляхом змішування води з сумішшю одного або більшої кількості розчинників з одним або більшою кількістю SFAs для забезпечення мимовільного утворення термодинамічно стабільного ізотропного рідкого складу. Сполука, запропонована в цьому винаході, спочатку міститься або в воді, або в суміші розчинник/SFA. Підходящі для використання в MEs розчинники включають описані вище для застосування в ECs або в EWs. ME може представляти собою систему олія-у-воді або вода-в-олії (визначити тип наявної системи можна шляхом вимірювання електропровідності) і вона може бути підходящою для змішування розчинних у воді і розчинних в олії пестицидів в одному і тому ж

препараті. ME придатна для розведення водою, в якій вона залишається мікроемульсією або утворює звичайну емульсію олія-у-воді.

[0105] Концентрати суспензії (SC) можуть включати водні або неводні суспензії тонкоподрібнених твердих частинок сполуки, запропонованої в цьому винаході. SCs можна отримати шляхом розмелювання на кульовому або бісерному млині твердої сполуки, запропонованої в цьому винаході, у відповідному середовищі, необов'язково з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів і отримати тонкоподрібнену суспензію сполуки. У композицію можна включити один або більшу кількість змочуючих агентів і можна включити суспендуючий агент для зниження швидкості осідання частинок. Альтернативно, сполуку, запропоновану в цьому винаході, можна піддати сухому розмелюванню і додати до води, що містить описані вище агенти, і отримати шуканий готовий продукт.

[0106] Аерозольні препарати включають сполуку, запропоновану в цьому винаході, і відповідний пропелент (наприклад, н-бутан). Сполуку, запропоновану в цьому винаході, також можна розчинити або диспергувати у підходящому середовищі (наприклад, у воді або рідині, що змішується з водою, такою як н-пропанол) і отримати композиції для використання в ємностях для розпилення, які не перебувають під тиском та працюють за допомогою ручних насосів.

[0107] Капсульовані суспензії (CS) можна отримати способом, схожим зі способом отримання препаратів EW, але з включенням додаткової стадії полімеризації, так щоб утворилася водна дисперсія крапельок олії, в якій кожна крапелька олії капсульована за допомогою полімерної оболонки і містить сполуку, запропоновану в цьому винаході, і необов'язково її носій або розчинник. Полімерну оболонку можна отримати за допомогою міжфазної реакції поліконденсації або за методикою коацервації. Композиції можуть використовуватися для регульованого виділення сполуки, запропонованої в цьому винаході, і їх можна використовувати для обробки насіння. Сполуку, запропоновану в цьому винаході, також можна включити до полімерної матриці, яка біологічно розкладається, і забезпечити повільне, регульоване виділення сполуки.

[0108] Композиція може включати одну або декілька добавок для покращення біологічних робочих характеристик композиції, наприклад, шляхом покращення змочування, утримування або розподілу на поверхнях; стійкості до впливу дощу на оброблені поверхні; або вбирання або рухливості сполуки, запропонованої в цьому винаході. Такі добавки включають поверхнево-активні речовини (SFAs), добавки для обприскування на основі олій, наприклад, деяких мінеральних олій або натуральних рослинних олій (таких як соєва олія і рапсова олія), і їх суміші з іншими підсилюючими біологічний вплив допоміжними речовинами (інгредієнтами, які можуть сприяти впливу сполуки, запропонованої в цьому винаході, або змінювати її вплив).

[0109] Змочуючі агенти, диспергуючі агенти і емульгуючі агенти можуть представляти собою SFAs катіоногенного, аніоногенного, амфотерного або неіоногенного типу.

[0110] Підходящі SFAs катіоногенного типу включають четвертинні амонієві сполуки (наприклад, цетилметиламонійбромід), імідазоліни і солі амінів.

[0111] Підходящі аніоногенні SFAs включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноєфірів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфонованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутилнафталінсульфонат і суміші диізопропіл- і триізопропілнафталінсульфонатів натрію), сульфати простих ефірів, сульфати простих ефірів спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), карбоксилати простих ефірів (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), фосфатні складні ефіри (продукти реакції одного або більшої кількості жирних спиртів з фосфорною кислотою (переважно складні моноєфіри) або з пентаоксидом фосфору (переважно складні дієфіри), наприклад, продукти реакції лаурилового спирту з тетрафосфорною кислотою; ці продукти також можуть бути етоксильовані), сульфосукцинамат, сульфонати парафінів або олефінів, таурати і лігносульфонати.

[0112] Підходящі SFAs амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати і гліцинати.

[0113] Підходящі SFAs неіоногенного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид, або їх сумішей з жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкіфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); часткові складні ефіри, отримані з жирних кислот з довгими ланцюгами або ангідридів гекситу; продукти конденсації зазначених часткових складних ефірів з етиленоксидом; блок-полімери (які включають етиленоксид і пропіленоксид); алканоламіни; звичайні складні ефіри (наприклад, поліетиленгліколеві ефіри жирних кислот); оксиди амінів (наприклад, лаурилдиметиламіноксид); і лецитини.

[0114] Підходящі суспендуючі агенти включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або натрієва сіль карбоксиметилцелюлози) та набухаючі глини (такі як бентоніт або атапульгіт).

5 [0115] Сполуку або композицію, запропоновану в цьому винаході, можна нанести на рослину, частину рослини, орган рослини, матеріал для розмноження рослини або ділянку проростання рослини.

10 [0116] Нанесення зазвичай здійснюють шляхом обприскування композицією, зазвичай за допомогою встановленого на тракторі обприскувача, призначеного для великих площ, але також можна використовувати інші методи, такі як обпилювання (для порошків), крапельне зрошення або просякнення. Альтернативно, композицію можна вносити в борозни або наносити прямо на насіння до або під час висівання.

15 [0117] Сполуку або композицію, запропоновану в цьому винаході, можна застосовувати до сходження або після сходження рослин. Переважно, якщо композицію застосовують для регулювання росту сільськогосподарських культур або посилення їх до абіотичних стресів, її можна використовувати після сходження сільськогосподарської культури. Якщо композицію застосовують для пригнічення або затримки проростання насіння, її можна використовувати до сходження.

20 [0118] Цей винахід включає нанесення сполук або композицій, запропонованих в цьому винаході, на матеріал для розмноження рослин до, під час або після висівання, або у вигляді будь-якої їх комбінації.

25 [0119] Хоча активні інгредієнти можна наносити на матеріал для розмноження рослин, що знаходиться в будь-якому фізіологічному стані, традиційним підходом є нанесення на насіння, що знаходяться в досить стійкому стані і не пошкоджувалося під час обробки. Зазвичай насінням повинно бути насіння, яке зібрали з поля, вийняли з рослини і відокремлені від качана, стебла, зовнішньої оболонки і навколишньої м'якоті або іншого ненасінневого рослинного матеріалу. Також бажано, щоб насіння було біологічно стабільне в такій мірі, щоб обробка не призводила до біологічного пошкодження насіння. Передбачається, що насіння можна обробити в будь-який час в період від збору насіння до висівання насіння або під час висівання.

30 [0120] Методи нанесення активних інгредієнтів на матеріал для розмноження рослин або ділянку їх проростання або обробки ними відомі в цій галузі техніки і включають протруювання, нанесення покриття, гранулювання і просякнення, а також нанесення в лотки для саджанців, нанесення в борозни, нанесення на ґрунт, введення в ґрунт, крапельне зрошення, нанесення за допомогою зрошувачих установок або обертового обприскувача, або введення в ґрунт (врозкид або смугами). Альтернативно або на додаток активні інгредієнти можна наносити на підходящу підкладку, яку висівають разом з матеріалом для розмноження рослин.

35 [0121] Норма витрат при нанесенні сполук, запропонованих в цьому винаході, може змінюватися в широких межах і залежить від типу ґрунту, методики нанесення (до або після проростання; протруювання насіння, внесення в борозни з насінням; без обробки ґрунту і т. п.), сільськогосподарської культури, переважаючих кліматичних умов і інших факторів, що впливають на методику нанесення, часу нанесення і цільової сільськогосподарської культури. У випадку некореневого нанесення або зрошення сполуку, запропоновану в цьому винаході, зазвичай наносять при нормі витрати, що дорівнює від 1 до 2000 г/га, а більш бажано - від 5 до 1000 г/га. У випадку обробки насіння норма витрати зазвичай дорівнює від 0,0005 до 150г/10 кг насіння.

45 [0122] Сполуки і композиції, запропоновані в цьому винаході, можна використовувати для дводольних або однодольних сільськогосподарських культур.

50 [0123] Культури корисних рослин, для яких можна використовувати композицію, запропоновану в цьому винаході, включають багаторічні та однорічні сільськогосподарські культури, такі як ягідні рослини, наприклад, чорниця, брусниця, журавлина, малина і суниця; злаки, наприклад, ячмінь, маїс (кукурудза), просо, овес, рис, жито, сорго, тритикале і пшениця; волокнисті рослини, наприклад, бавовник, льон, конопля, джут і сизаль; польові культури, наприклад, цукровий та кормовий буряк, кава, хміль, гірчиця, олійний рапс (канола), мак, цукрова тростина, соняшник, чай і тютюн; плодові дерева, наприклад, яблуня, абрикос, авокадо, банан, вишня, цитрусові, нектарин, персик, груша і слива; трав'янисті рослини, наприклад, Бермудська трава, тонконіг, мітлиця звичайна, еремохля змієхвоста, костриця, плевел, Августінова трава і трава цойсія; пряні трави, такі як базилік, бораго, шніт-цибуля, коріандр, лаванда, любисток лікарський, м'ята, материнка, петрушка, розмарин, шавлія і чебрець; овочеві рослини, наприклад, квасоля, сочевиця, горох і соя; горіхові, наприклад, мигдаль, кеш'ю, арахіс, фундук, арахіс, горіх пекан, фісташка і волоський горіх; пальмові, наприклад, олійна пальма; декоративні рослини наприклад, квіткові, чагарники і дерева; інші дерева, наприклад, какао,

кокос, олива і каучукове дерево; овочі, наприклад, спаржа, баклажан, броколі, капуста, морква, огірок, часник, салат-латук, кабачок, диня, бамія, цибуля, перець, картопля, гарбуз, ревінь, шпинат і томат; і в'юнкі рослини, наприклад, виноград.

5 [0124] Сільськогосподарські культури є такими, якими вони є в природі, отримані за допомогою звичайних методів селекції або отримані за допомогою методів генної інженерії. Вони включають культури, які містять так звані корисні ознаки (наприклад, покращену стабільність при зберіганні, великий вміст поживних речовин і покращений смак).

10 [0125] Сільськогосподарські культури також включають такі культури, яким надано стійкість до гербіцидів, таким як бромоксиніл, або класів гербіцидів, таким як інгібітори ALS, EPSPS, GS, HPPD і PPO. Прикладом культури, якій надана стійкість до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу, за допомогою звичайних методик селекції, є яра канولا Clearfield®. Приклади культур, яким надано стійкість до гербіцидів за допомогою методів генної інженерії, включають наприклад, стійкі до гліфосату і глүфосинату сорти кукурудзи, що продаються під торговими назвами RoundupReady®, Herculex I® та LibertyLink®.

15 [0126] Сільськогосподарські культури також є такими, які за своєю природою стійкі або їм надано стійкість до шкідливих комах. Вони включають рослини, перетворені за допомогою методики рекомбінантних ДНК, наприклад, яким надано здатність синтезувати один або більшу кількість селективно діючих токсинів, таких як відомі, наприклад, для продукуючих токсини бактерій. Приклади токсинів, які можуть експресуватися, включають δ-ендотоксини, рослинні інсектицидні білки (Vip), інсектицидні білки бактерій, що колонізують нематоди, і токсини, які продукують скорпіони, павукоподібні, оси та гриби.

20 [0127] Прикладом сільськогосподарської культури, яка модифікована для експресування токсину *Bacillus thuringiensis*, є кукурудза Bt KnockOut® (Syngenta Seeds). Прикладом сільськогосподарської культури, яка містить більше одного гена, який кодує стійкість до інсектициду і таким чином експресує більше одного токсину, є VipCotO (Syngenta Seeds). Сільськогосподарські культури або їх насіннєвий матеріал також можуть бути стійкими до багатьох типів шкідників (так звані суміщені трансгенні прояви, утворені за допомогою генетичної модифікації). Наприклад, рослина може мати здатність експресувати інсектицидний білок і одночасно є стійкою до гербіциду, наприклад, Herculex IO (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

30 [0128] Сполуку, запропонована в цьому винаході, також можна використовувати для пригнічення або затримки проростання насіння рослин, які не є культурними, наприклад, як частину об'єднаної програми боротьби з бур'янами. Затримка проростання насіння бур'янів може дати сіянці сільськогосподарської культури, які швидше ростуть внаслідок ослаблення конкуренції з бур'янами.

35 [0129] Альтернативно, сполуки, запропоновані в цьому винаході, можна використовувати для затримки проростання насіння сільськогосподарських культур, наприклад, через те, що фермеру надається можливість змінити час висівання.

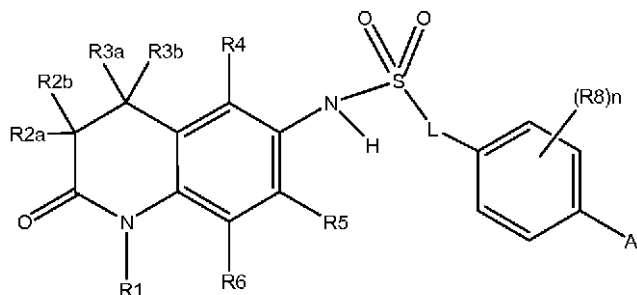
40 [0130] Зазвичай при проведенні агротехнічних робіт фермер використовує один або більшу кількість інших агрохімікатів або біологічних засобів на додаток до сполуки або композиції, запропонованої в цьому винаході. Цей винахід також відноситься до суміші, яка містить сполуку або композицію, запропоновану в цьому винаході, і додатковий активний інгредієнт.

45 [0131] Приклади агрохімікатів або біологічних засобів включають пестициди, такі як акарициди, бактерициди, фунгіциди, гербіциди, інсектициди, нематодициди, регулятори росту рослин, підсилючі сільськогосподарську культуру агенти, антидоти, а також поживні речовини для рослин і добрива для рослин. Приклади підходящих для змішування компонентів наведені в публікації Pesticide Manual, 15th edition (published by the British Crop Protection Council). Такі суміші можна використовувати для рослини, матеріалу для розмноження рослин або ділянки зростання рослини одночасно (наприклад, попередньо приготованої суміші або бакової суміші) або послідовно в потрібному часовому режимі. Спільне нанесення пестицидів разом з продуктами, запропонованими в цьому винаході, володіє тією додатковою перевагою, що для фермера скорочуються витрати часу при нанесенні продуктів на сільськогосподарські культури. Комбінація також може забезпечувати конкретні ознаки рослини, які надаються рослині за допомогою будь-яких засобів, наприклад, звичайних методик селекції або генетичної модифікації.

55 [0132] Цей винахід також відноситься до застосування сполуки формули (I), (II), або (III), в якій R1, R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5, R6, L, A, R8 та n є такими, як визначено в цьому винаході; або його солей або N-оксидів; або композиції, яка містить сполуку формули (I), (II), або (III) і сільськогосподарсько прийнятної допоміжної речовини, для покращення стійкості рослини до

абіотичних стресів, регулювання або покращення росту рослин, пригнічення проростання насіння та/або захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів.

[0133] У деяких варіантах реалізації цей винахід стосується застосування сполуки формули (I)



I

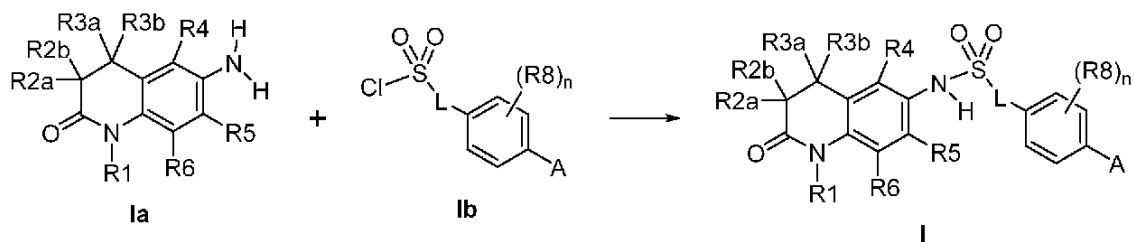
в якій R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл та C₄-C₅-гетероциклоалкіл; або R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл; R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; R2a та R2b, або R2a та R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням C₃-C₄-циклоалкілу; L обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу; A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 Ry; кожен Ry незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, -OH, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₄-циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR_{9a}R₉ та NHCOR₉, за умови, що, якщо один або більша кількість Ry означають =O, =N-OH або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл; R₉ та R_{9a} незалежно означають C₁-C₄-алкіл; кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₆-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл; n обраний з групи, що включає 1, 2 та 3; або її солей чи N-оксидів; або композиції, яка містить сполуку формули (I) і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину, для покращення стійкості рослини до абіотичних стресів, регулювання або покращення росту рослин, пригнічення проростання насіння та/або захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів.

[0134] Цей винахід також відноситься до застосування сполуки, композиції або суміші, запропонованої в цьому винаході, для покращення стійкості рослини до абіотичних стресів, регулювання або покращення росту рослин, пригнічення проростання насіння та/або захисту рослини від фітотоксичного впливу хімікатів.

Синтез

[0135] Сполуки, запропоновані в цьому винаході, синтезують звичайним способом. Для синтезу сполук, запропонованих в цьому винаході, можна використовувати методики синтезу, відомі в цій галузі техніки і описані в цьому винаході, з використанням відповідних попередників. На схемах 1-3 представлені типові методики отримання сполук формули (I).

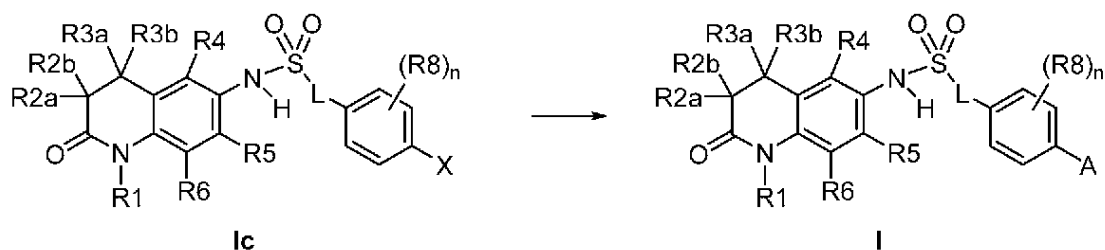
СХЕМА 1:



[0136] Сполуки формули (I) можна отримати з сполуки формули (Ia) і сульфонілхлориду формули (Ib) в присутності органічної основи, такої як триетиламін.

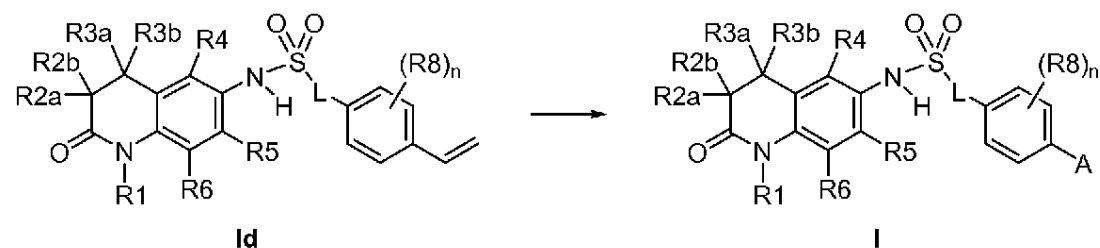
[0137] Сульфонілхлориди формули (Ib) є в продажу або їх може отримати фахівець в цій галузі техніки за методиками, відомими з літератури.

СХЕМА 2:



[0138] Сполуки формули (I) можна отримати з сполуки формули (Ic), в якій X означає підходящу групу для відщеплення, таку як, наприклад, галоген або трифлат, шляхом поєднання з похідним формули Z-A, в якій Z означає похідне бору або олова і A є таким, як описано для сполуки формули (I), в присутності підходящої системи каталізатор/ліганд, часто комплексу паладію (0). Ці реакції можна провести при нагріванні мікрохвильовим випромінюванням. Ці реакції відомі фахівцям в цій галузі техніки під назвами поєднання за Стіллі, Судзукі, див., наприклад, публікацію: Strategic Applications of Named Reactions in Organic Synthesis Kurti, Laszlo; Czako, Barbara; Editors. USA. (2005), Publisher: Elsevier Academic Press, Burlington, Mass. p.448 (поєднання за Судзукі) і p.438 (поєднання за Стіллі) і цитовану в ній літературу.

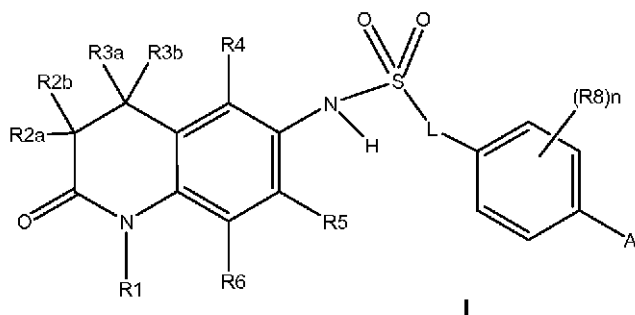
СХЕМА 3:



[0139] Сполуки формули (I), в якій A означає C-4-циклоалкільне кільце, можна отримати зі сполуки формули (Id) за реакцією кетену або кетенімінієвих солей, як, наприклад, описано в публікації Tetrahedron Letters 55 (2014 року) 5147-5150.

[0140] Типові синтези різних сполук, запропонованих в цьому винаході, наведені в прикладі 1.

[0141] У підсумку в типових варіантах реалізації цей винахід відноситься до: сполуки формули (I):



або її солям чи N-оксидам. R1 обраний з групи, що включає водень, алкіл, ціаноалкіл, галогеналкіл, алкоксіалкіл, галогеналкоксіалкіл, циклоалкілалкіл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл і гетероциклоалкіл; або R1 обраний з групи, що включає алкіларил, циклоалкіл, феніл і гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx. Кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл і циклоалкіл. R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, галогеналкіл, галогеналкоксигрупу і циклоалкіл. R2a і R2b, або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням циклоалкілу. L обраний з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкоксигрупу і алкоксіалкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл і алкоксигрупу. A означає циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 Ry. Кожен Ry незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, алкіл, галогеналкіл, -OH, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR₉aR₉ та NHCOR₉. Якщо один або більша кількість Ry означають =O, =N-OH або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл. R₉ і R₉a незалежно означають алкіл. Кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл, циклоалкіл і алкоксіалкіл. n обраний з групи, що включає 1, 2 і 3.

[0142] Сполуки за попереднім параграфом, в якій кожен Rx незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл.

[0143] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій Rx обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл.

[0144] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R1 обраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл та C₄-C₅-гетероциклоалкіл; або R1 обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл або 5- або 6-члений гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx.

[0145] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R1 обраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-члений гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або R1 обраний з групи, що містить водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл.

[0146] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R1 означає C₁-C₆-алкіл.

[0147] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 та R6 незалежно обрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл; R2a та R2b, або R2a та R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням C₃-C₄-циклоалкілу.

[0148] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R2a, R2b, R3a, R3b, R4 та R5 всі означають водень.

[0149] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R6 обраний з групи, що включає водень та C₁-C₄-алкіл.

5 [0150] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій щонайменше один з R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 не означає водень.

[0151] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій L обраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно обраних з групи, що
10 включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу.

[0152] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій L означає C₁-C₂-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно обраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл.

[0153] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій L означає C₁-C₂-алкіл.

15 [0154] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій кожен R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, -ОН, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₄-циклоалкіл, =O, =N-ОН, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉,
20 CONR_{9a}R₉ та NHCOR₉. Якщо один або більша кількість R_y означають =O, =N-ОН або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл. R₉ та R_{9a} незалежно означають C₁-C₄-алкіл;

[0155] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій R_y незалежно обраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, -ОН, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₄-галогеналкіл.

25 [0156] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 R_y.

[0157] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій A означає циклопропіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 фрагментів, незалежно обраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₂-алкіл та C₁-C₂-галогеналкіл.

[0158] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій кожен R₈ незалежно обраний з
30 групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₆-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл.

35 [0159] Сполуки за будь-яким з попередніх параграфів, в якій кожен R₈ незалежно обраний з групи, що включає водень, галоген і C₁-C₄-алкіл; та n обраний з групи, що включає 1 та 2.

[0160] Композиції, що містять сполуки, визначені в будь-якому попередньому параграфі, і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

40 [0161] Суміші, що містять сполуки, визначені в будь-якому попередньому параграфі, і додатковий активний інгредієнт.

[0162] Спосіб покращення стійкості рослини до абіотичних стресів, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким попереднім параграфом, композиції за будь-яким попереднім параграфом, або суміші за будь-яким попереднім параграфом.

45 [0163] Спосіб пригнічення проростання насіння рослини, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким попереднім параграфом, композиції за будь-яким попереднім параграфом, або суміші за будь-яким попереднім параграфом.

50 [0164] Спосіб регулювання або покращення росту рослин, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким попереднім параграфом, композиції за будь-яким попереднім параграфом, або суміші за будь-яким попереднім параграфом.

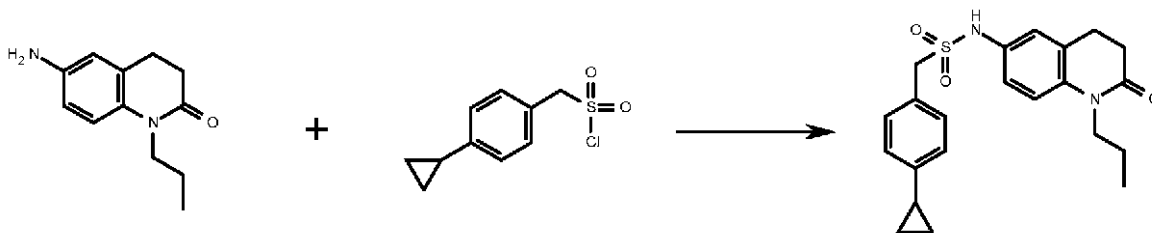
55 [0165] Спосібом захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів, що включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким попереднім параграфом, композиції за будь-яким попереднім параграфом, або суміші за будь-яким попереднім параграфом.

[0166] Матеріали і способи, запропоновані в цьому винаході, додатково ілюструються наведеними нижче прикладами. Ці приклади наведені для ілюстрації, а не для обмеження заявленого винаходу.

60 ПРИКЛАДИ

Приклад 1: Синтези
Отримання

1-(4-циклопропілфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (сполука 1.001)



5

[0167] 6-Аміно-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-2-он (50 мг, 0,245 ммоль) розчиняли в етилацетаті (1,22 мл) і охолоджували до 0 °С в атмосфері аргону. Додавали N, N'-диізопропілетиламін (85,3 мкл, 0,490 ммоль). Потім по краплях додавали розчин (4-циклопропілфеніл)метансульфонілхлориду (188 мг, 0,367 ммоль) в етилацетаті (1 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Потім повільно додавали водний розчин HCl (1M) і шари розділяли. Органічний шар промивали водним розчином Na₂CO₃ і водою, сушили над Na₂SO₄ і концентрували у вакуумі і отримували 173 мг неочищеного продукту, який хроматографували на силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували 1-(4-циклопропілфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (75,6 мг, 0,190 ммоль, 77 %) у вигляді бежевої порошкоподібної речовини, ¹H ЯМР (CDCl₃, 400 МГц) δ 0,70 (2H, m); 0,98 (5H, m); 1,67 (2H, секстет, J=8); 1,90 (1H, m); 2,65 (2H, t, J=8); 2,85 (2H, t, J=8); 3,87 (2H, t, J=8); 4,30 (2H, s); 6,05 (1H, s); 6,95 (3H, m); 7,05 (2H, d, J=10); 7,20 (2H, d, J=10); LC-MS (рідинна хроматографія - мас-спектроскопія) хроматографія: RT (час утримування, хв): 0,98, [M+H] (вимірюваний): 399.

Отримання 1-[4-(2,2-диметил-3-оксоциклобутил)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (сполука 8.004)

1) N-(2-Оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)-1-(4-вінілфеніл)метансульфонамід

[0168] 1-(4-Бромфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (55 мг, 126 ммоль) розчиняли в 2-метилтетрагідрофурані (0,99 мл) і воді (0,11 мл). Додавали трифторо(вініл)борат калію (20,2 мг, 0,151 ммоль) і карбонат цезію (123 мг, 0,377 ммоль). Реакційну суміш дегазували, додавали PdCl₂(PPh₃)₂ (4,5 мг, 0,006 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °С протягом 15 год. Потім її охолоджували до кімнатної температури і виливали в суміш лід/вода. Водний шар двічі екстрагували етилацетатом. Органічний шар промивали водою, потім розсолон, сушили над Na₂SO₄ і концентрували в умовах зниженого тиску і отримували 78 мг неочищеного продукту, який хроматографували на силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)-1-(4-вінілфеніл)метансульфонамід (30 мг, 0,627 ммоль, 63 %). ¹H ЯМР (CDCl₃, 400 МГц) δ 0,97 (3H, t, J=7); 1,66 (2H, m); 2,63 (2H, dd, J=9, 6); 2,84 (2H, m); 3,87 (2H, m); 4,32 (2H, s); 5,31 (1H, d, J=11); 5,77 (1H, d, J=18); 6,21 (1H, s); 6,70 (1H, dd, J=18, 11); 6,94 (3H, m); 7,28 (2H, d, J=8); 7,40 (2H, d, J=8).

2) 1-[4-(2,2-Диметил-3-оксоциклобутил)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід

[0169] В атмосфері аргону до 1-(2-метилпроп-1-еніліден)піперидин-1-трифторметансульфонату (1,6 мл, 0,260 ммоль, 0,16 моль/л в CDCl₃, отриманий, як описано в публікації Tetrahedron Letters 55 (2014) 5147-5150) при 0 °С додавали розчин N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)-1-(4-вінілфеніл)метансульфонамід (100 мг, 0,260 ммоль) в хлороформі (1,6 мл). Реакційну суміш перемішували протягом 3 годин при кімнатній температурі, потім додавали 1-(2-метилпропіл-1-еніліден)піперидин-1-трифторметансульфонат (1,6 мл, 0,260 ммоль, 0,16 моль/л в CDCl₃) і реакційну суміш перемішували протягом ще 20 хв при кімнатній температурі. Потім додавали 1 н. водний розчин HCl (1 мл). Водний шар двічі екстрагували дихлорметаном. Органічний шар промивали водою, потім розчином NaHCO₃, сушили над Na₂SO₄ і концентрували в умовах зниженого тиску і отримували 150 мг неочищеного продукту, який хроматографували на силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували 1-[4-(2,2-диметил-3-оксоциклобутил)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (102 мг, 0,863 ммоль, 86 %) у вигляді олії; ¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ част./млн 0,79 (3H, s); 0,97 (3H, t, J=7); 1,36 (3H, s); 1,67 (2H, m); 2,65 (2H, dd, J=8, 6); 2,88

(2H, m); 3,37 (3H, m); 3,91 (2 H, m); 4,33 (2H, s); 6,35 (s, 1 H); 6,93 (1 H, m); 6,98 (1H, m); 7,03 (1H, d, J=2); 7,21 (2H, d, J=8); 7,32 (2H, d, J=8).

Отримання 1-(4-циклобутилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (сполука 5.004)

5 [0170] В атмосфері аргону 1-(4-бромфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (100 мг, 0,228 ммоль) і [метансульфонато(2-дициклогексилфосфіно-2',6'-диізопропокси-1,1'-біфеніл)(2'-метиламіно-1,1'-біфеніл-2-іл)паладій(II)] (8,63 мг, 0,011 ммоль) розчиняли в тетрагідрофурані (2,3 мл), по краплях додавали циклобутилбромід цинку (0,91 мл, 0,457 ммоль) і реакційну суміш перемішували протягом 18 год. при кімнатній температурі. Потім
10 реакційну суміш виливали на лід і додавали кілька мілілітрів насиченого розчину NH_4Cl . Водний шар тричі екстрагували етилацетатом. Органічні шари об'єднували, промивали розсолон, сушили над Na_2SO_4 і концентрували в умовах зниженого тиску і отримували 106 мг неочищеного продукту, який хроматографували на силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували 1-(4-циклобутилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (77 мг, 0,187 ммоль, 82 %) у вигляді блідо-жовтої спіненої речовини; ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ част./млн 0,97 (3H, t, J=7); 1,65 (2H, m); 1,86 (1H, m); 2,06 (3H, m); 2,35 (2H, m); 2,63 (2H, dd, J=8, 6); 2,85 (2H, m); 3,53 (1H, m); 3,83 (2H, m); 4,29 (2H, s); 6,40 (1H, s); 6,92 (3H, m); 7,21 (4H, m).

Отримання 1-(4-циклопентилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (сполука 9.004)

20 1) 1-[4-(Циклопентен-1-іл)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід
[0171] 1-(4-Бромфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (219 мг, 0,500 ммоль) розчиняли в 2-метилтетрагідрофурані (3,5 мл): Реакційну суміш дегазували, потім
25 додавали циклопентил-1-ілборонову кислоту (72,8 мг, 0,650 ммоль), фторид цезію (380 мг, 2,5 ммоль) і $\text{PdCl}_2\text{dppf}_2$ (20,4 мг, 0,025 ммоль). Реакційну суміш опромінювали в мікрохвильовій печі протягом 15 хв при 110 °C, потім виливали на лід з водою. Водний шар двічі екстрагували етилацетатом. Органічний шар промивали розчином NaHCO_3 , водою і потім розсолон, сушили над Na_2SO_4 і концентрували в умовах зниженого тиску і отримували неочищений продукт, який
30 хроматографували на силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували 185 мг продукту. Його суспендували в метанолі, нагрівали і потім охолоджували до кімнатної температури, фільтрували і промивали метанолом і отримували 1-[4-(циклопентил-1-іл)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (162 мг, 0,381 ммоль, 76 %) у вигляді бежевих кристалів; ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d_6 (диметилсульфоксид)) δ част./млн 0,88 (3H, t, J=7); 1,53 (2H, m); 1,97 (2H, m); 2,50 (4H, m); 2,61 (2H, m); 2,79 (2H, t, J=7); 3,81 (2H, m); 4,43 (2H, s); 6,30 (1H, br. s.); 6,98 (1H, s); 7,06 (2H, m); 7,24 (2H, d, J=8); 7,43 (2H, m, J=8); 9,67 (1H, s).

2) 1-(4-Циклопентилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід
[0172] В атмосфері аргону 1-[4-(циклопентен-1-іл)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (99 мг, 0,233 ммоль) суспендували в суміші етанол-етилацетат (7 мл/7 мл), потім додавали Pd/C (10 %, 9,9 мг, 0,040 ммоль). Реакційну суміш перемішували в атмосфері водню протягом 20 год. при 45 °C. Потім водень видаляли за допомогою аргону і реакційну суміш фільтрували через шар целіту®. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску і отримували 106 мг неочищеного продукту, який хроматографували на
45 силікагелі в градієнтному режимі етилацетат/гексан і отримували 1-(4-циклопентилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід (77 мг, 0,18 ммоль, вихід 77 %) у вигляді безбарвних кристалів; ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ част./млн 0,97 (3H, t, J=7); 1,56 (3H, m); 1,70 (3H, m); 1,82 (2H, m); 2,07 (2H, m); 2,64 (2H, dd, J=8, 6); 2,85 (2H, m); 3,00 (1H, m); 3,88 (2H, m); 4,30 (2H, s); 6,21 (1H, s); 6,95 (3H, m); 7,22 (4H, m).

50 [0173] Зазначені нижче сполуки одержували за методикою, описаною вище, або шляхом поєднання 6-амінохінолінону з відповідним сульфонілхлоридом. 6-Аміноамінохінолінони отримували за відомими методикам з родинних сполук, як це описано, наприклад, в публікаціях Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, 1981, (11), 2912-19 і WO2014210555.

Сполука	Назва сполуки	LCMS (RT, хв)	Маса (M+H+)
1.004	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	0,98	399
1.025	N-(8-хлор-2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)-1-(4-циклопропілфеніл)метансульфонамід	1,04	433
1.214	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(8-фтор-2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	1,07	417
1.225	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(1-метил-2-оксо-8-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	0,99	413,3
1.178	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(1-етил-4-метил-2-оксо-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	0,96	400
1.213	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(1-етил-8-фтор-2-оксо-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	0,98	403
1.220	1-(4-циклопропілфеніл)-N-(1-етил-8-фтор-4-метил-2-оксо-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	1,00	417
9.004	1-(4-циклопентилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	1,09	427
8.004	1-[4-(2,2-диметил-3-оксоциклобутил)феніл]-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	0,94	455
5.004	1-(4-циклобутилфеніл)-N-(2-оксо-1-пропіл-3,4-дигідрохінолін-6-іл)метансульфонамід	1,05	414

Методика LC-MS - стандартна: (SQD-ZDQ-ZCQ)

5 [0174] Спектри знімали на мас-спектрометрі Waters (SQD або ZQ мас-спектрометр з одною квадрупольною лінзою), забезпеченому джерелом електророзпилення (полярність: позитивні чи негативні іони, капіляр: 3,00 кВ, діапазон для конуса: 30-60 В, екстрактор: 2,00 В, температура джерела: 150 °С, температура десольватації: 350 °С, швидкість потоку газу через конус: 0 л/ч, швидкість потоку газу десольватації: 650 л/ч, діапазон мас: 100-900 Тау) та Acquity UPLC from Waters: насос для роботи з двома розчинниками, камера колонки з підігрівом і детектор з діодною матрицею. Пристрій для дегазації розчинника, насос для роботи з двома розчинниками, камера колонки з підігрівом і детектор з діодною матрицею. Колонка: Waters UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30×2,1 мм, Температура: 60 °С, детектор з діодною матрицею, діапазон довжин хвиль (нм): 210-500, градієнтний режим для розчинника: А=вода+5 % MeOH+0,05 % НСООН, В=ацетонітрил+0,05 % НСООН: градієнтний режим: 0 хв 0 % В, 100 % А; 1,2-1,5 хв 100 % В; швидкість потоку (мл/хв) 0,85.

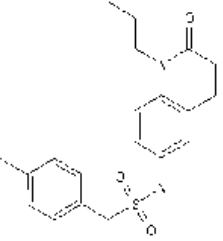
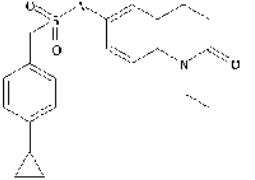
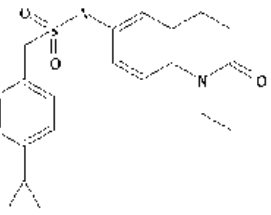
Приклад 2: Біологічні дослідження

А) Підвищена ефективність використання води (WU) для сої

20 [0175] Досліджували ефективність хімікатів за їх впливом на зменшення споживання води рослиною (WU) після некореневого нанесення на рослини сої (сорт S20-G7), вирощені в камерах з регульованим середовищем для вирощування рослин. Всі хімікати наносили з використанням препарату емульгуючого концентрату (ЕС), який розводили водою, що містить додаткову поверхнево-активну речовину (EXTRAVON 1 г/20 л), до зазначених концентрацій. WU для рослини визначали за методикою зважування безлічі горщиків до і після нанесення хімікатів в зазначені моменти часу (представлені у вигляді кількості днів після нанесення (DAA)). Дані за WU до нанесення використовували для коригування відмінностей використання води, не пов'язаних з наслідками обробки (наприклад, внаслідок відмінностей розмірів рослин). Результати наведені в зіставленні з обробкою, що є негативним контролем (вода з додаванням EXTRAVON 1 г/20 л).

30 [0176] Нанесення хімікатів (0 DAA) проводили приблизно від 8 до 9:30 до полудня. WU визначали в денний час (камеру висвітлювали від 6:00 до 20:00) в наступні моменти часу: 0 DAA до полудня (10:30-12:50) і 0 DAA після полудня (14:00-19:50), 1 DAA до полудня (7:30-12:50) і 1 DAA після полудня (14:00-19:50) і 2 DAA до полудня (7:30-12:50). Сумарне повне WU (0-2 DAA) розраховували шляхом підсумовування значень WU, зазначених вище.

35 ТАБЛИЦЯ В1: Виражене у відсотках збільшення або зменшення використання води (WU) для рослин сої, обприсканих зазначеними хімікатами, в порівнянні з обробкою, що є негативним контролем (наприклад, 0=відповідає негативному контролю; -8,5 = -8,5 % зменшення WU в порівнянні з обробкою, що є негативним контролем). Наведено середні значення WU для 6 горщиків (в кожному знаходилися 3 рослини) для однієї обробки

Сполука	Норма витрати, мкМ	% WU 0 DAA до полудня	% WU 0 DAA після полудня	% WU 1 DAA до полудня	% WU 1 DAA після полудня	% WU 2 DAA до полудня	Всього % WU від 0 до 2 DAA
 Хінабактин	100	-1,3	-0,7	-2,2	-0,2	-3,4	-2,0
 Сполука 1.004	100	-0,8	-3,8	-3,0	-2,8	-5,2	-3,8
 Сполука 1.004	500	-8,8	-10,7	-9,4	-6,4	-6,1	-8,9

[0177] Результати свідчать, що сполуки, запропоновані в цьому винаході, призводять до кращого використання води рослиною ніж хінабактин.

5 ТАБЛИЦЯ В2: Повторний експеримент з включенням інших сполук.

Сполука	% WU 0 DAA до полудня	% WU 0 DAA після полудня	% WU 1 DAA до полудня	% WU 1 DAA після полудня	% WU 2 DAA до полудня	% WU 2 DAA після полудня	Всього % WU від 0 до 2 DAA
ДМСО	0	0	0	0	0	0	0
Хінабактин	-22	-23	-17	-15	-12	-11	-16
1.004	-40,5	-36,4	-28,7	-23,2	-18	-12,9	-25
1.025	-27,2	-31,9	-25,6	-23,1	-15,8	-13,6	-22,1
1.178	-44,8	-50,9	-52,1	-47,2	-41,7	-36,5	-45,4
1.213	-42,4	-48,1	-52,6	-46,5	-45,7	-38,7	-45,8
1.220	-48,3	-56	-55,7	-52,4	-47,5	-44,6	-50,5
9.004	-7	-3	-2	0,1	0	0,5	-1,4
8.004	-5,5	-0,1	-1,2	1,7	-0,4	1	-0,7
5.004	-21,6	-14	0,1	2,4	2,8	3,9	-3

А) Підвищена ефективність використання води (WU) для кукурудзи

10 [0178] Ефективність сполук за їхнім впливом на зменшення споживання води рослиною досліджували наступним чином. Сполуки наносили шляхом некореневого обприскування на рослини кукурудзи у віці 12 днів (сорт NK OCTET), вирощені в камерах з регульованим середовищем для вирощування рослин. Всі сполуки наносили з використанням препарату емульгуючого концентрату (ЕС), який розводили до бажаних концентрацій водою, що містить 0,4 % допоміжної речовини, метилового ефіру ріпакової олії. Використання води рослинами 15 протягом дня оцінювали шляхом зважування горщиків, в яких вирощували рослини, до і після нанесення сполук в зазначені моменти часу (представлені у вигляді кількості днів після нанесення (DAA)). Дані щодо використання води до нанесення використовували для

коригування відмінностей використання води, непов'язаних з наслідками обробки (наприклад, внаслідок відмінностей розмірів рослин). Неперетворені значення використання води піддавали коваріаційному аналізу, апроксимуючи результат обробки і з застосуванням базового використання води за 1 до нанесення як коваріант.

5 [0179] Нанесення хімікатів (0 DAA) проводили приблизно від 8 до 9:30 до полудня. WU визначали в денний час (камеру висвітлювали від 6:00 до 20:00) в наступні моменти часу: 0 DAA до полудня (10:30-12:50) і 0 DAA після полудня (14:00-19:50), 1 DAA до полудня (7:30-12:50) і 1 DAA після полудня (14:00-19:50) і 2 DAA до полудня (7:30-12:50). Сумарне повне WU (0-2 DAA) розраховували шляхом підсумовування значень WU, зазначених вище.

10 ТАБЛИЦЯ В3: Виражене у відсотках збільшення або зменшення використання води (WU) для рослин кукурудзи, обприсканих зазначеними хімікатами при концентрації 500 мкМ, в порівнянні з обробкою, що є негативним контролем (наприклад, 0=відповідає негативному контролю; -5,0=5,0 % зменшення WU в порівнянні з обробкою, що є негативним контролем). Наведено середні значення WU для 6 горщиків (в кожному знаходилися 3 рослини) для однієї
15 обробки

Сполука	% WU 0 DAA до полудня	% WU 0 DAA після полудня	% WU 1 DAA до полудня	% WU 1 DAA після полудня	% WU 2 DAA до полудня	% WU 2 DAA після полудня	Всього % WU від 0 до 2 DAA
1.004	-17,9	-12,4	-12,4	-12,1	-9,8	-10,2	-11,8
1.178	-18,5	-13	-11,2	-9,2	-6,5	-5,8	-9,7
1.213	-18,2	-15,5	-13,4	-11,2	-7,9	-7	-11,4
1.220	-32,6	-35,1	-18,2	-14,1	-8,7	-9	-17,8
5.004	-8,9	-8,8	-5,6	-5,9	-1,7	-2,3	-4,9

С) Дослідження активності PP2C

20 [0180] Білок HAB1, протеїнфосфатаза типу 2 (PP2C), інгібується білками PYR/PYL в залежності від абсцизової кислоти або інших агоністів рецептора. Активність агоністів рецептора корелює зі ступенем інгібування PP2C і тому IC₅₀ (PYR1-HAB1) можна використовувати для зіставлення відносної активності різних хімічних аналогів. Оскільки інгібування PP2C корелює з інгібуванням проростання насіння і збільшенням ефективності використання води рослинами, воно є ефективним засобом кількісної оцінки біологічного
25 потенціалу хімікату, який діє, як аналог абсцизової кислоти.

[0181] Білки HAB1 та PYL експресували і очищали, як це описано в публікації Park et al. ((2009) Science 324(5930):1068-1071), з невеликими змінами. Для отримання GST-HAB1, HAB1 cDNA клонували в рGex-2T. Експресування проводили в клітинах господаря BL21[DE3]pLysS. Трансформовані клітини попередньо вирощували протягом ночі, переносили в середовище LB і
30 вирощували при 30 °C до A600, рівного ~ 0,5.

[0182] Потім культуру охолоджували на льоду і додавали MnCl₂ до 4 мМ і IPTG додавали до 0,3 мМ. Після інкубації протягом 16 год. при 15 °C клітини збирали і рекомбінантні білки очищали на агарозі з глутатіоном, як це описано в публікації Park et al. Для отримання рецепторних білків злиття 6XHis-PYL, використовували експресуючі конструкції, описані раніше
35 в публікації Okamoto et al. 2013, (PNAS 110(29): 12132-12137). ABA рецептори експресували і очищали, як описано вище.

[0183] Для отримання значень, наведених в таблиці В5, дослідження активності PP2C з використанням рекомбінантних рецепторів і PP2Cs проводили наступним чином: очищені білки попередньо інкубували в 160 мкл буфера для аналізу, що містить 100 мМ Tris-HCl-pH7,9, 100
40 мМ NaCl, 3 мкг бичачого сироваткового альбуміну, 0,1 % 2-меркаптоетанолу, 1 мМ MnCl₂ з додаванням ABA або агоністів (сполуки, запропоновані в цьому винаході) протягом 30 хв при кімнатній температурі. Реакції ініціювали шляхом додавання 40 мл реакційного розчину, що містить 25 мМ 4-нітрофенілфосфату в буфері для аналізу, після чого результати вимірювання поглинання відразу накопичували з використанням випромінювання з довжиною хвилі 405 нм на
45 зчитувальному пристрої для планшетів Wallac. Реакційні суміші містили 100 нМ PP2C і 200 нМ білків PYR/PYL. Деякі аналоги хінабактину володіють власною флуоресценцією, тому для аналізів фосфатази було необхідно використовувати нефлуоресцюючий субстрат 4-нітрофенолфосфат. Для отримання значень IC₅₀ проводили розрахунки з використанням значень аналізів рецептор/PP2C, проведених при різних концентраціях (в діапазоні від 1 мкМ до
50 4 нМ). Отриману залежність доза-відповідь апроксимували залежністю log (інгібітор) від відповіді (змінний нахил) з використанням нелінійної регресії для отримання значень IC₅₀ із застосуванням програмного забезпечення Graph Pad Prism 6.0.

ТАБЛИЦЯ В5: Інгибування PYR1 і PYL2.

Сполуки	IC ₅₀ для інгибування PYR1-HAB1 (нМ)	IC ₅₀ для інгибування PYL2-HAB1 (нМ)
Хінабактин	104	262
1.004	51	177
1.025	83	114
1.178	200	101
1.179	82	64
1.214	28	130
1.178	200	101
1.213	21	244
1.220	71	16
9.004	97	>1000

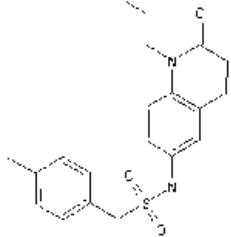
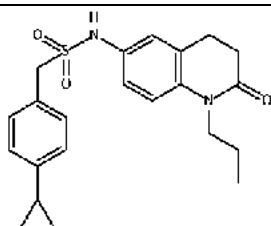
5 [0184] Результати свідчать, що сполуки, запропоновані в цьому винаході, призводять до кращого інгибування PP2C ніж хінабактин.

С) Дослідження пригнічення проростання арабідопсису

10 [0185] Для дослідження впливу сполук на пригнічення проростання насіння арабідопсису після дозрівання протягом приблизно 4 тижнів стерилізували протягом 10 хв на поверхні розчином, що містить 5 % NaClO та 0,05 % Tween-20, і чотири рази промивали водою. Стерилізовані насінини суспендували в 0,1 % агарі і висівали на 0,8 % затверділому агарному середовищі, що містить солі ½ Murashige і Skoog (MS) (Sigma-Aldrich) при проведенні відповідної обробки, зберігали при 4 °C протягом 4 днів, і потім переводили в середовище при 22 °C в темряві. Пророщування визначали через 3 дні.

ТАБЛИЦЯ В6: Ступінь проростання насіння арабідопсису

15

Сполука	Проростання, % при 1 мкМ	Проростання, % при 5 мкМ
 Хінабактин	46	0
 Сполука 1.004	42	0

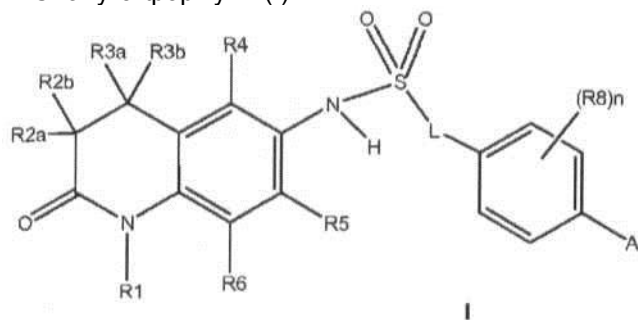
[0186] Результати свідчать, що сполуки, запропоновані в цьому винаході, призводять до більш ефективного пригнічення проростання арабідопсису ніж хінабактин.

20 Слід розуміти, що приклади і варіанти реалізації, описані в цьому винаході, наведені тільки з ілюстративною метою і що фахівець в цій галузі техніки з урахуванням опису може внести різні модифікації або зміни, які входять в суть і обсяг заявки і обсяг доданої формули винаходу. Всі публікації, патенти і заявки на патенти, цитовані в цьому винаході, включені в нього як посилання для всіх об'єктів.

25

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I):



5 в якій:

R1 вибраний з групи, що включає водень, алкіл, ціаноалкіл, галогеналкіл, алкоксилалкіл, галогеналкоксилалкіл, циклоалкілалкіл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл і гетероциклоалкіл; або

10 R1 вибраний з групи, що включає алкіларил, циклоалкіл, феніл і гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx;

кожен Rx незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл і циклоалкіл;

15 R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 незалежно вибрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, галогеналкіл, галогеналкоксигрупу і циклоалкіл; R2a і R2b або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням циклоалкілу;

20 L вибраний з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкоксигрупу і алкоксилалкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно вибраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, алкіл і алкоксигрупу;

A означає циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 Ry;

25 кожен Ry незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, алкіл, галогеналкіл, -ОН, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR9, CONHR9, CONR9aR9 та NHCOR9, за умови, що, якщо один або більша кількість Ry означають =O, =N-OH або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл;

R9 і R9a незалежно означають алкіл;

30 кожен R8 незалежно вибраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілсульфаніл, галогеналкілсульфаніл, алкілсульфініл, галогеналкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкілсульфоніл, алкеніл, галогеналкеніл, алкініл, галогеналкініл, циклоалкіл і алкоксилалкіл;

n вибраний з групи, що включає 1, 2 і 3;

або її солі або N-оксиди.

35 2. Сполука за п. 1, в якій Rx незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл та C₃-C₄-циклоалкіл.

40 3. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій кожен Rx незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл.

4. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій

45 R1 вибраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₃-галогеналкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл і C₄-C₅-гетероциклоалкіл; або

R1 вибраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіларил, C₃-C₅-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx.

5. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій

50 R1 вибраний з групи, що включає C₃-C₄-циклоалкіл, феніл та 5- або 6-членний гетероарил, кожен необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 Rx; або

R1 вибраний з групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₃-алкокси-C₁-C₃-алкіл, C₁-галогеналкокси-C₁-C₃-алкіл, C₃-C₄-циклоалкіл-C₁-C₃-алкіл, C₂-C₆-алкеніл та C₂-C₆-алкініл.

6. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій R1 означає C₁-C₆-алкіл.

5 7. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій

R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 та R6 незалежно вибрані з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу та C₃-C₄-циклоалкіл;

10 R2a і R2b або R2a і R3a разом з атомом, до якого вони приєднані, необов'язково з'єднані з утворенням C₃-C₄-циклоалкілу.

8. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій R2a, R2b, R3a, R3b, R4 та R5 всі означають водень.

9. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій R6 вибраний з групи, що включає водень та C₁-C₄-алкіл.

15 10. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій щонайменше один з R2a, R2b, R3a, R3b, R4, R5 і R6 не означає водень.

11. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій L вибраний з групи, що включає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, кожен з яких необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 3 фрагментів, незалежно вибраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл та C₁-C₄-алкоксигрупу.

20 12. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій L означає C₁-C₂-алкіл, необов'язково заміщений одним або двома фрагментами, незалежно вибраними з групи, що включає галоген, ціаногрупу і C₁-C₂-алкіл.

13. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій L означає C₁-C₂-алкіл.

25 14. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій кожен R_y незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, -ОН, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₄-циклоалкіл, =O, =N-OH, -N=OMe, COOH, COOR₉, CONHR₉, CONR₉aR₉ та NHCOR₉, за умови, що, якщо один або більша кількість R_y означають =O, =N-OH або -N=OMe, A не означає C₃-циклоалкіл; R₉ та R₉a незалежно означають C₁-C₄-алкіл.

15. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій кожен R_y незалежно вибраний з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, -ОН, C₁-C₄-алкоксигрупу та C₁-C₄-галогеналкіл.

35 16. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій A означає C₃-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 R_y.

17. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій A означає циклопропіл, необов'язково заміщений за допомогою від 1 до 4 фрагментів, незалежно вибраних з групи, що включає галоген, ціаногрупу, C₁-C₂-алкіл та C₁-C₂-галогеналкіл.

40 18. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій кожен R₈ незалежно вибраний з групи, що включає водень, галоген, ціаногрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкілсульфаніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфаніл, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галогеналкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₃-C₆-циклоалкіл та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл.

45 19. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій кожен R₈ незалежно вибраний з групи, що включає водень, галоген і C₁-C₄-алкіл; та n вибраний з групи, що включає 1 та 2.

20. Композиція, що містить сполуку за будь-яким з попередніх пунктів і сільськогосподарсько прийнятну допоміжну речовину.

50 21. Суміш, що містить сполуку за будь-яким з пп. 1-19 і додатковий активний інгредієнт.

22. Спосіб покращення стійкості рослини до абіотичного стресу, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким з пп. 1-19, композиції за п. 20 або суміші за п. 21.

55 23. Спосіб пригнічення проростання насіння рослини, де спосіб включає нанесення на насіння або ділянку, що містить насіння, сполуки за будь-яким з пп. 1-19, композиції за п. 20 або суміші за п. 21.

24. Спосіб регулювання або покращення росту рослин, де спосіб включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким з пп. 1-19, композиції за п. 20 або суміші за п. 21.

25. Спосіб захисту рослини від фітотоксичних впливів хімікатів, що включає нанесення на рослину, частину рослини, матеріал для розмноження рослин або ділянку проростання рослин сполуки за будь-яким з пп. 1-19, композиції за п. 20 або суміші за п. 21.