



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **113737** (13) **C2**
(51) МПК (2017.01)

C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/06 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01P 3/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

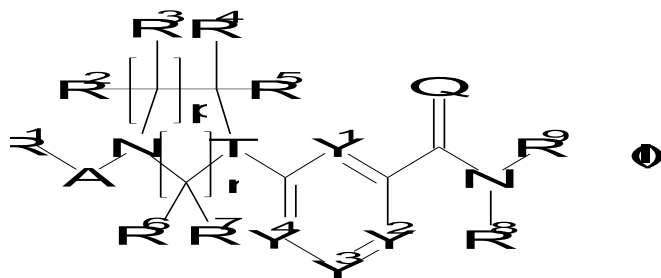
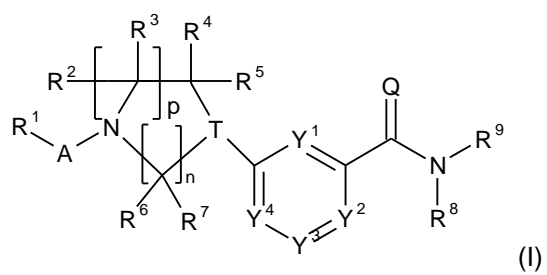
(21) Номер заявки: а 2014 00686	(72) Винахідник(и): Сюльзе-Мосс Сара (FR/CH), Ламберт Клеменс (DE/CH), Седербаум Фредрік Еміль Малкольм (SE/CH)
(22) Дата подання заявки: 27.06.2012	(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 10.03.2017	(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 61/503,257	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 2011018415, A, 17.02.2011 WO 2011018401, A, 17.02.2011
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 30.06.2011	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: US	
(41) Публікація відомостей про заявку: 10.04.2014, Бюл.№ 7	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.03.2017, Бюл.№ 5	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: РСТ/EP2012/062428, 27.06.2012	

(54) МІКРОБІОЦИДНІ ГЕТЕРОЦИКЛИ

(57) Реферат:

Винахід стосується гетероциклічних сполук формули I, які мають мікробіоцидну активність, зокрема, фунгіцидну активність, а також способів застосування сполуки формули I для боротьби з мікроорганізмами.

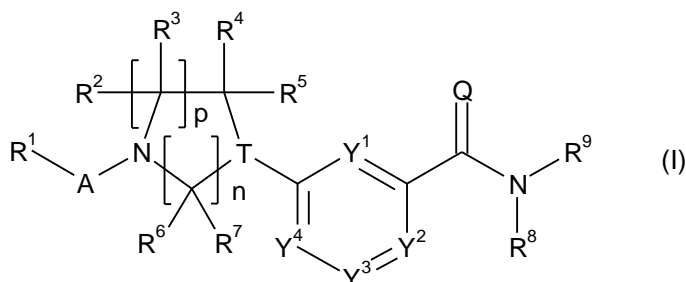
UA 113737 C2



Даний винахід стосується гетероциклів, наприклад, як активних інгредієнтів, які мають мікробіцидну активність, зокрема, фунгіцидну активність. Даний винахід також стосується одержання даних гетероциклів, похідних гетероциклів, застосовуваних як проміжні продукти під час одержання даних гетероциклів, одержання даних проміжних продуктів, агрохімічних композицій, які містять щонайменше один з гетероциклів, одержання даних композицій та застосування гетероциклів або композицій у сільському господарстві або садівництві для боротьби із зараженням або запобігання зараженню рослин, зібраних продовольчих культур, насіння або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибами.

Через те, що екологічні та економічні вимоги до сучасних пестицидних засобів безупинно змінюються, існує постійна потреба в пошуку та розробці нових фунгіцидів з переважними властивостями порівняно з відомими продуктами. На подив, у даний момент було виявлено, що описані похідні біс(дифторметил)піразолу мають для практичних цілей досить ефективний рівень біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинюваних грибами.

Даний винахід стосується сполуки формули I:



де

A являє собою $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$, $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$ або $x-N=C(R^{30})-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

T являє собою CR^{18} або N;

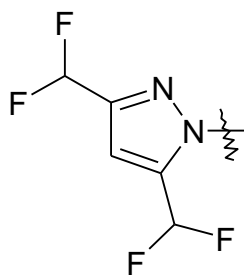
Y^1, Y^2, Y^3 і Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N;

Q являє собою O або S;

n дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо n дорівнює 2, то p дорівнює 1.

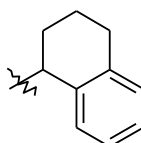
R^1 являє собою



кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}$ та R^{30} незалежно являє собою водень, галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл;

кожний з R^8, R^{14} та R^{15} незалежно являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл; та

R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



(a),

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками,

незалежно обраними з C₁-C₄алкілу, C₁-C₄галогеналкілу, галогену, ціано, гідроксі та аміно; або її солі або N-оксиду.

Якщо зазначено, що замісники необов'язково заміщені, це означає, що вони можуть нести або можуть не нести один або декілька ідентичних або різних замісників. Одночасно присутніми

звичайно є не більше трьох таких необов'язкових замісників.

Термін "галоген" означає фтор, хлор, бром або йод.

Термін "аміно" означає -NH₂.

Алкільні, алкенільні або алкінільні замісники можуть мати прямий або розгалужений ланцюг. Алкіл, сам по собі або як частина іншого замісника, являє собою, залежно від кількості згаданих атомів вуглецю, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, н-гексил та їх ізомери, наприклад, ізопропіл, ізобутил, втор-бутил, трет-бутил, ізоаміл або півалоїл.

Галогеналкільна група може містити один або декілька ідентичних атомів галогену та, наприклад, може означати CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₃CH₂, CH₃CF₂, CF₃CF₂ або CCl₃CCl₂.

Наявність одного або декількох можливих асиметричних атомів вуглецю в сполучі формули I означає, що сполуки можуть траплятися у формах оптичних ізомерів, тобто енантіомерних або діастереоізомерних формах. Як результат наявності можливого подвійного зв'язку C=C в аліфатичному ланцюгу може мати місце геометрична ізомерія, тобто цис-транс- або (E)-(Z)-ізомерія. Також, як результат обмеженого обертання навколо одинарного зв'язку можуть траплятися атропоізомери. Передбачається, що формула I включає всі дані можливі ізомерні форми та їх суміші. Даний винахід включає всі дані можливі ізомерні форми та їх суміші для сполуки формули I. Аналогічно передбачається, що формула I включає всі можливі таутомери. Даний винахід включає всі можливі таутомерні форми для сполуки формули I.

У кожному випадку сполуки формули I за даним винаходом перебувають у вільній формі, в окисненій формі N-оксид або у формі солі, наприклад, у формі агрономічно застосовної солі.

N-оксиди являють собою окиснені форми третинних амінів або окиснені форми азотовмісних гетероароматичних сполук. Вони описані, наприклад, у книзі "Heterocyclic N-oxides" by A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991.

Придатні солі сполук формули I включають солі, одержані в результаті приєднання кислоти, такі як солі з неорганічною кислотою, наприклад, соляною, бромоводневою, сірчаною, азотною або фосфорною кислотою, або органічною карбоною кислотою, наприклад, щавлевою, виннокам'яною, молочною, масляною, толуїловою, капроною або фталевою кислотою, або сульфокислотою, наприклад, метан-, бензен- або толуенсульфокислотою.

Сполука формули I переважно являє собою сполуку, де:

A являє собою x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)-, x-N(R¹⁴)-C(=O)-, x-N(R¹⁵)-C(=S)- або x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R¹;

T являє собою CR¹⁸ або N;

Y¹, Y², Y³ та Y⁴ незалежно являють собою CR¹⁹ або N;

Q являє собою O або S;

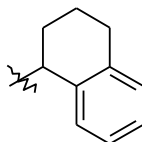
n дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо n дорівнює 2, то p дорівнює 1.

кожний з R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ та R¹⁹ незалежно являє собою водень, галоген, ціано, C₁-C₄алкіл або C₁-C₄галогеналкіл;

кожний з R⁸, R¹⁴ та R¹⁵ незалежно являє собою водень або C₁-C₄алкіл; та

R⁹ являє собою феніл, бензил або групу (a):



(a),

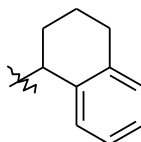
де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C₁-C₄алкілу, C₁-C₄галогеналкілу, галогену, ціано, гідроксі та аміно; або її сіль або N-оксид.

Сполука формули I переважно являє собою сполуку, де:

A являє собою x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)- або x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R¹;

T являє собою CR¹⁸ або N;

Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} ;
Q являє собою O або S;
n дорівнює 1 або 2;
5 р дорівнює 1;
кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл;
 R^8 являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл; та
10 R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



(a),

де кожний з фенілу, бензила та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, галогену, ціано, гідроксі та аміно.

Сполука формули I переважно являє собою сполуку, де:

A являє собою $x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CR^{16}R^{17}-SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

T являє собою CR^{18} ;

20 Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} , та за умови, що в кільці, яке містить Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки;

Q являє собою O або S;

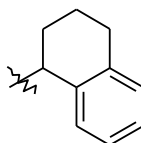
n дорівнює 1 або 2;

25 р дорівнює 1;

кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, фтор або метил;

R^8 являє собою водень або метил; та

30 R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a)



(a),

35 де кожний з фенілу, бензила та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, гідроксі та галогену.

Сполука формули I переважно являє собою сполуку, де:

A являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CH_2-SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

T являє собою CH;

40 Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CH або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CH, та за умови, що в кільці, яке містить Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки;

Q являє собою O;

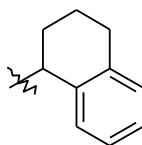
n дорівнює 1 або 2;

45 р дорівнює 1;

кожний з R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 та R^7 являє собою водень;

R^8 являє собою водень або метил; та

R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a)



(a),

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C₁-C₄алкілу, C₁-C₄галогеналкілу, гідроксі та галогену.

Сполука формули I переважно являє собою сполуку, де:

A являє собою x-CH₂-C(=O)-, де x вказує на зв'язок, з'єднаний з R¹;

T являє собою CH;

Y¹, Y², Y³ та Y⁴ незалежно являють собою CH;

Q являє собою O;

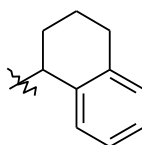
n дорівнює 2;

p дорівнює 1;

кожний з R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ являє собою водень;

R⁸ являє собою водень або метил; та

R⁹ являє собою феніл, бензил або групу (a)



(a),

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з метилу, галогенметилу та галогену.

Даний винахід також стосується сполук формули I, де

A являє собою x-CH₂-C(=O)-, x-CH₂C(=S)-, x-OC(=O)-, x-CH₂SO₂-, при цьому в кожному випадку x вказує на зв'язок з R¹;

T являє собою CH або N;

Y¹, Y², Y³ та Y⁴ незалежно являють собою CH або N за умови, що щонайменше 2 з Y¹, Y², Y³ та Y⁴ являють собою CH, та за умови, що в кільці, яке містить Y¹, Y², Y³, відсутні N-N-зв'язки;

Q являє собою O або S;

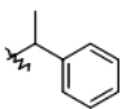
n дорівнює 1 або 2;

p являє собою 1 або 2 за умови, що якщо n дорівнює 2, то p дорівнює 1;

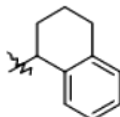
кожний з R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ являє собою водень;

R⁸ являє собою водень або метил;

R⁹ являє собою групу (i), (j) або (k):



(i)



(j)



(k)

У наведеному далі переліку даються визначення, у тому числі переважні визначення, для замісників A, T, Y¹, Y², Y³, Y⁴, Q, n, p, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵ та R³⁰ щодо сполук формули I. Для кожного з даних замісників кожне з наведених нижче визначень можна комбінувати з будь-яким визначенням будь-якого іншого наведеного нижче замісника. Даний винахід включає сполуки формули з усіма можливими комбінаціями наведених нижче або в інших частинах даного документа визначень замісників. У цілому, у даному документі будь-яке визначення замісника можна комбінувати з будь-яким іншим визначенням замісника.

A являє собою x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)-, x-N(R¹⁴)-C(=O)-, x-N(R¹⁵)-C(=S)- або x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R¹.

Переважно, А являє собою $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 . Переважніше, А являє собою $x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CR^{16}R^{17}-SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 . Ще переважніше, А являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, $x-CH_2-C(=S)-$, $x-OC(=O)-$, $x-CH_2SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 . Та ще переважніше, А являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CH_2-SO_2-$, у кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 . Найпереважніше, А являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, де x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 .

Т являє собою CR^{18} або N. Переважно, Т являє собою CH або N. Найпереважніше, Т являє собою CH.

n дорівнює 1 або 2. Переважно, n дорівнює 2.

r дорівнює 1 або 2 за умови, що якщо n дорівнює 2, то r дорівнює 1. Переважно, r дорівнює 1.

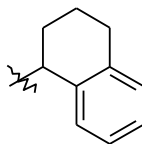
Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N, наприклад, Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно можуть являти собою CH або N. Переважніше, Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} . Ще переважніше, Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} , та за умови, що в кільці, яке містить Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки. Та ще переважніше, Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CH або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CH, та за умови, що в кільці, яке містить Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки.

Q являє собою O або S. Переважно, Q являє собою O.

Кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл. Переважніше, кожен з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл. Ще переважніше, кожен з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, фтор або метил. Та ще переважніше, кожен з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} являє собою водень.

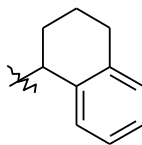
Кожний з R^8, R^{14} та R^{15} незалежно являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл. Переважно, кожен з R^8, R^{14} та R^{15} незалежно являє собою водень або метил. Переважно, кожен з R^8, R^{14} та R^{15} являє собою водень.

R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



(a),

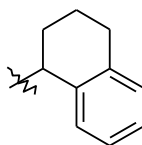
де кожен з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, галогену, ціано, гідроксі та аміно. Переважно, R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



(a),

де кожен з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, гідроксі та галогену.

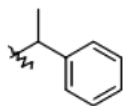
Переважніше, R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



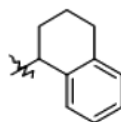
(a),

5 де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з метилу, галогенметилу та галогену.

В одній групі сполук R^9 являє собою (i), (j) або (k):



(i)



(j)



(k)

10 R^{30} являє собою водень, галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл. Переважно, R^{30} являє собою водень, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл. Переважно, R^{30} являє собою водень, фтор або метил. Переважніше, R^{30} являє собою водень.

В одній групі сполук щонайменше два з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH, а інші з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH або N.

15 В одній групі сполук щонайменше три з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH, а інший з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являє собою CH або N.

В одній групі сполук Y^1 та Y^4 являють собою CH, один з Y^2 та Y^3 являє собою CH, а інший з Y^2 та Y^3 являє собою CH або N.

В одній групі сполук Y^1 , Y^2 та Y^4 являють собою CH, а Y^3 являє собою N.

20 В одній групі сполук Y^1 , Y^3 та Y^4 являють собою CH, а Y^2 являє собою N.

В одній групі сполук Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH.

В одній групі сполук Y^2 являє собою N.

В одній групі сполук Y^3 являє собою N.

В одній групі сполук p дорівнює 1, а n дорівнює 2.

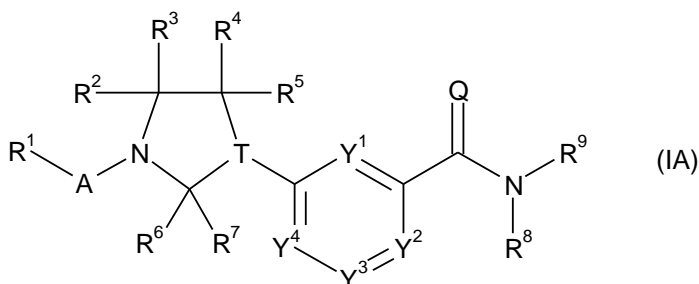
25 В одній групі сполук R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 являють собою H.

В одній групі сполук Q являє собою O.

В одній групі сполук A являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, у якій x являє собою зв'язок, з'єднаний з R^1 .

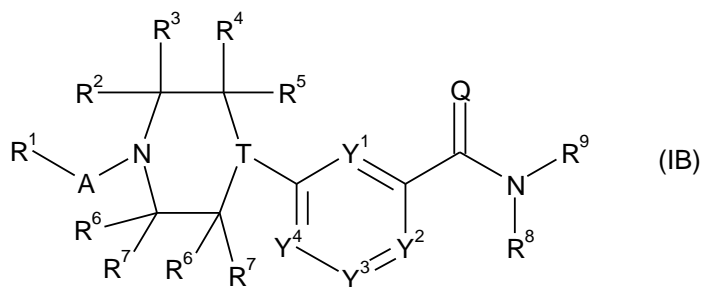
В одній групі сполук R^8 являє собою водень.

30 Щоб уникнути різночитань, якщо n дорівнює 1 і p дорівнює 1, то сполуки формули I мають формулу згідно з формулою IA:



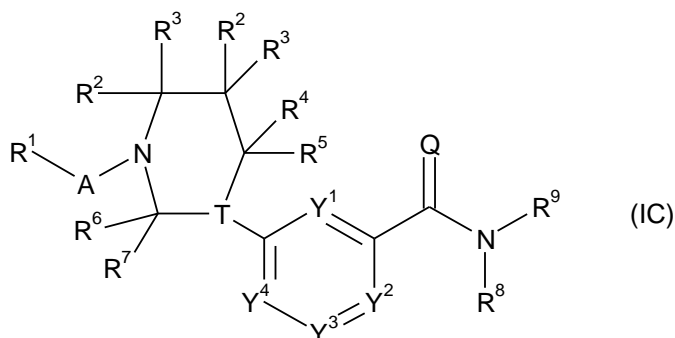
35 у якій A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 мають визначення, описані для формули I.

Якщо n дорівнює 2 і p дорівнює 1, то сполуки формули I мають формулу згідно з формулою IB:



у якій A, T, G, Y¹, Y², Y³, Y⁴, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ мають визначення, описані для формули I.

5 Якщо n дорівнює 1 і p дорівнює 2, то сполуки формули I мають формулу згідно з формулою IC:

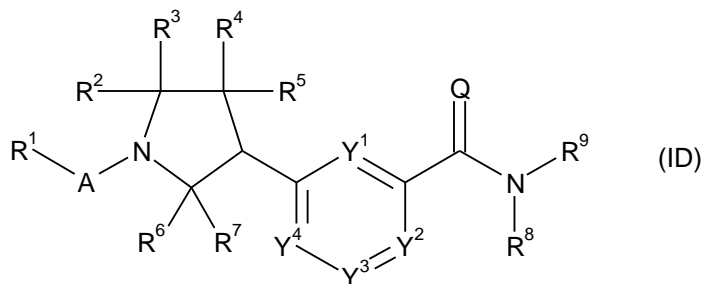


10 у якій A, T, G, Y¹, Y², Y³, Y⁴, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ мають визначення, описані для формули I.

Даний винахід також стосується показаних вище сполук формули IA, формули IB та формули IC.

Даний винахід також стосується сполук формули ID:

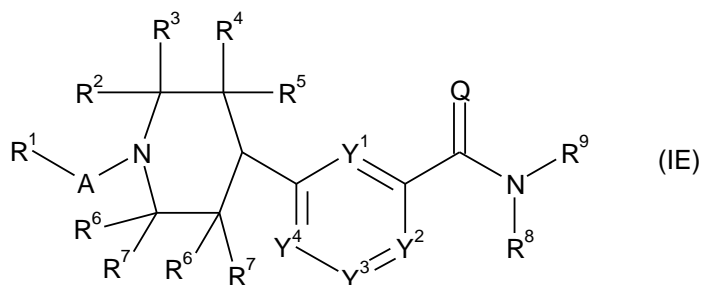
15



де Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ мають визначення, описані для наведеної вище формули I. Переважні визначення Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ наведені вище.

20

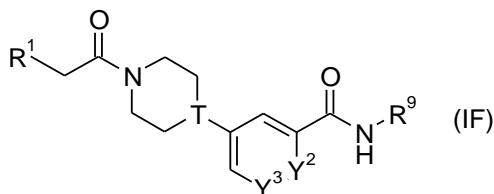
Даний винахід також стосується сполук формули IE:



де Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 мають визначення, описані для наведеної вище формули I. Переважні визначення Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 наведені вище.

Даний винахід також стосується сполуки формули IF:

5



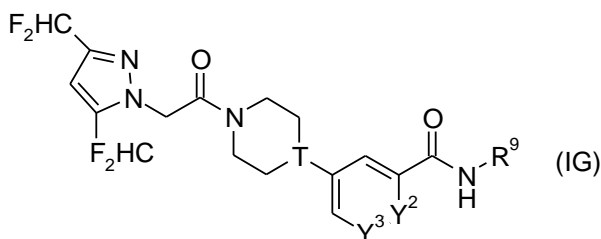
де T являє собою N або CH;

Y^2 та Y^3 обидва являють собою CH, або один з Y^3 та Y^2 являє собою N, а інший являє собою

10 CH; та

R^1 та R^9 описано для сполуки наведеної вище формули I. Переважні визначення R^1 та R^9 наведено вище.

Даний винахід також стосується сполуки формули IG:



15

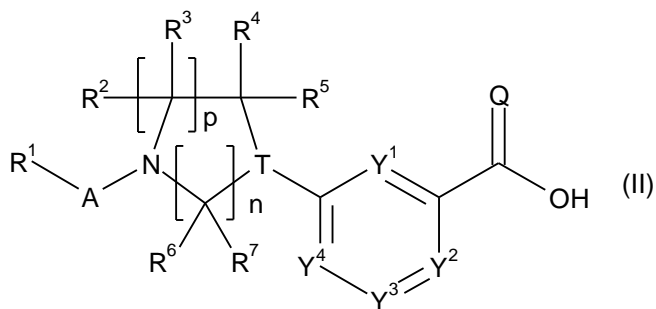
де T являє собою N або CH;

Y^2 та Y^3 обидва являють собою CH, або один з Y^3 та Y^2 являє собою N, а інший являє собою

CH; та

20 R^9 описано для сполуки наведеної вище формули I. Переважні визначення R^9 наведено вище.

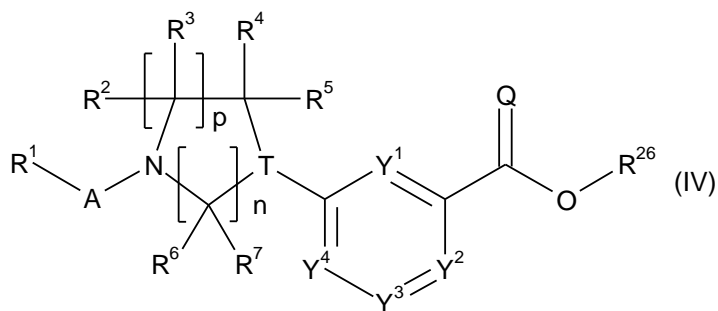
Даний винахід також стосується інших проміжних продуктів, придатних в одержанні сполук формули I. Отже, даний винахід стосується сполуки формули II:



25

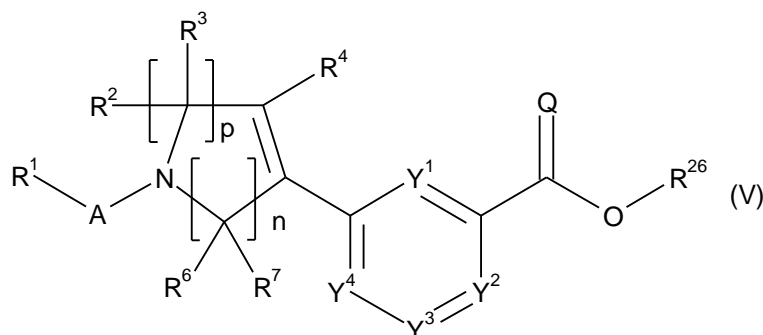
де Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 мають визначення, описані для наведеної вище формули I. Переважні визначення Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 наведено вище.

30 Даний винахід стосується сполуки формули IV:



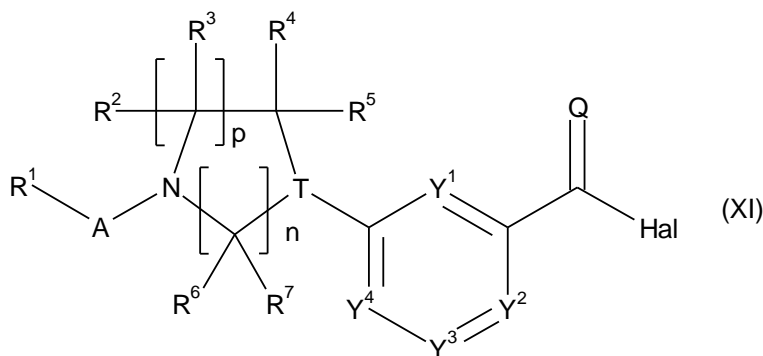
де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають визначення, описані для наведеної вище формули I, а переважні визначення $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 наведено вище; і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил. Переважно, R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, гідроксилу, аміно, ціано та галогену.

Даний винахід стосується сполуки формули V:



де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для наведеної вище формули I, а переважні визначення $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^6$ та R^7 наведено вище; і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил. Переважно, R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно обраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, гідроксилу, аміно, ціано та галогену.

Даний винахід стосується сполуки формули XI:



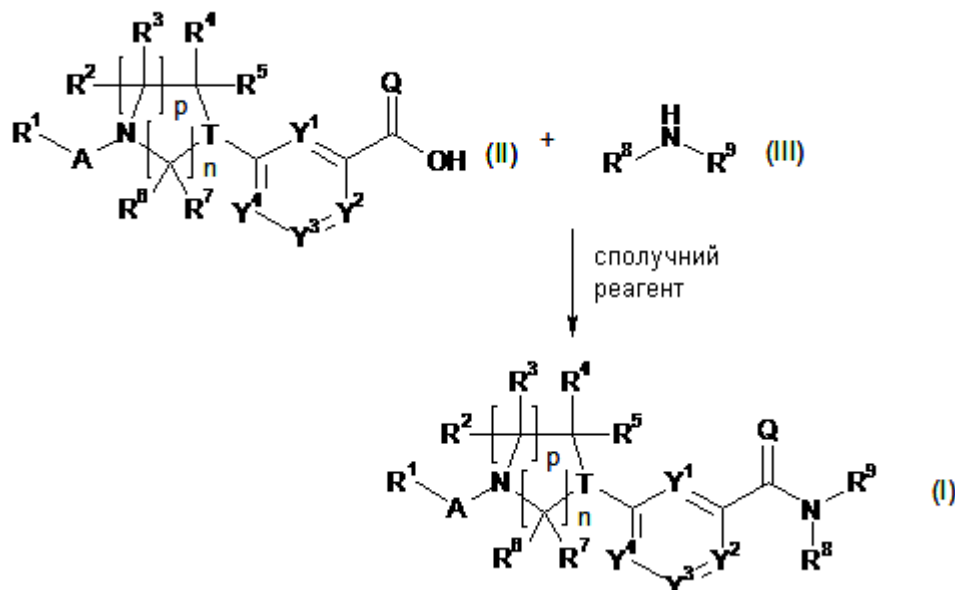
де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для наведеної вище формули I, а переважні визначення $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 наведено вище; Hal означає галоген.

Сполуки формули (I) можна одержати за допомогою способів, аналогічних описаним в WO2011/018401, і як показано в наведених далі схемах.

Сполуки формули I, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, A, T, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, можна одержати в результаті перетворення сполуки формули II, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, за допомогою сполуки формули III, де R^8 та R^9 є такими, як визначено для

формули I, та реагенту, що утворює пептидний зв'язок, такого як BOP, PyBOP, HATU. Це зображено на схемі 1.

Схема 1

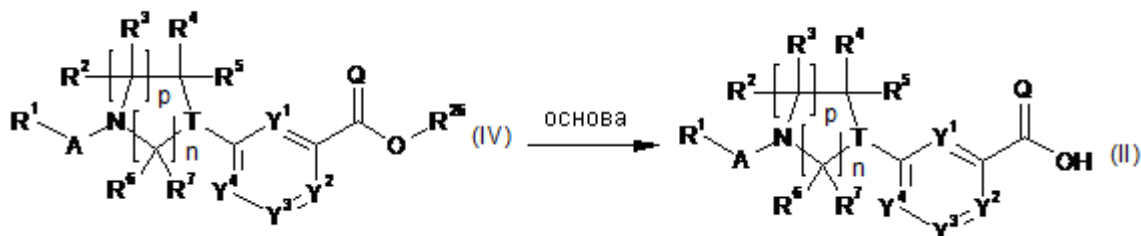


5

Сполуки формули II, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, можна одержати шляхом омилення сполуки формули IV, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, за допомогою основи, такої як гідроксид калію, гідроксид натрію, гідроксид літію, карбонат кальцію, карбонат натрію тощо. Це зображено на схемі 2.

10

Схема 2

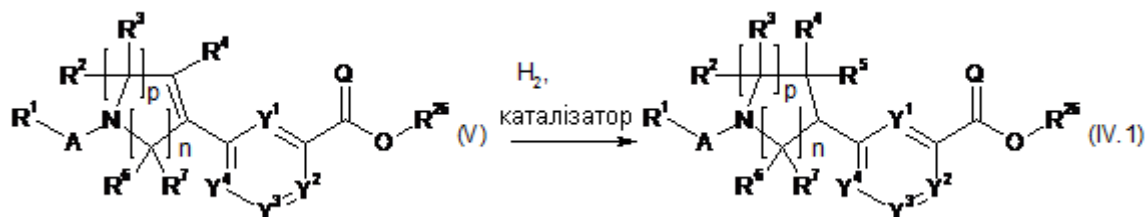


15

Сполуки формули IV.1, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, можна одержати шляхом відновлення сполуки формули V, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, A, Y^1, Y^2, Y^3$ та Y^4, n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, за допомогою водню та каталізатора, такого як паладій на вугільній основі, кістковий нікель тощо, або алюмогідриду літію. Це зображено на схемі 3.

20

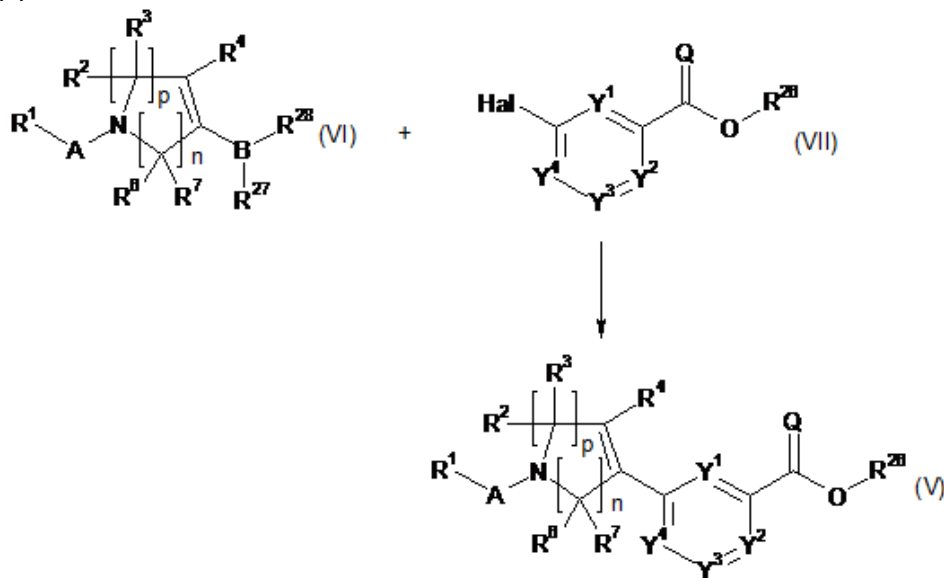
Схема 3



25

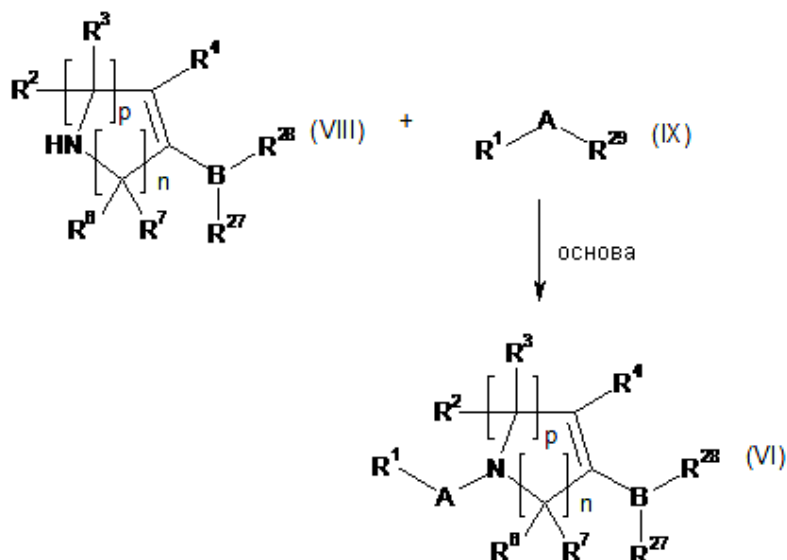
Сполуки формули V, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , A, Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, можна одержати шляхом перетворення сполуки формули VI, де R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , R^7 , n, p та A є такими, як визначено для формули I, і кожний з R^{27} та R^{28} незалежно являє собою гідроксі або C_1 - C_6 алкіл або разом із суміжним атомом бору утворюють п'яти- або шестичленне насичене гетероциклічне кільце, за допомогою сполуки формули VII, де Y^1 , Y^2 , Y^3 , та Y^4 , та Q є такими, як визначено для формули I, R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, а Hal являє собою галоген, переважно йод, бром або хлор, та каталізатора. Це зображено на схемі 4.

Схема 4



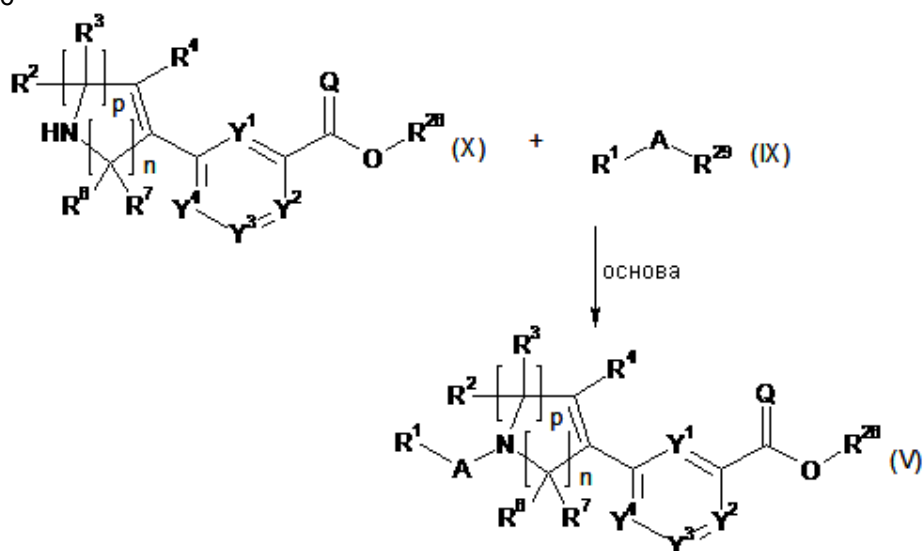
Сполуки формули VI, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , n, p та A є такими, як визначено для формули I, а кожний з R^{27} і R^{28} незалежно являють собою гідроксі або C_1 - C_6 алкіл або разом із суміжним атомом бору утворюють п'яти- або шестичленне гетероциклічне кільце, можна одержати шляхом перетворення сполуки формули VIII, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , n та p є такими, як визначено для формули I, а кожний з R^{27} та R^{28} незалежно являє собою гідроксі або C_1 - C_6 алкіл або разом із суміжним атомом бору утворює п'яти- або шестичленне насичене гетероциклічне кільце, за допомогою сполуки формули IX, де R^1 та A є такими, як визначено для формули I, і R^{29} являє собою гідроксі або галоген, переважно фтор, хлор або бром, та реагенту, що утворює пептидний зв'язок, або основи, такої як піридин, триетиламін, етилдіізопропіламін тощо. Це зображено на схемі 5.

Схема 5



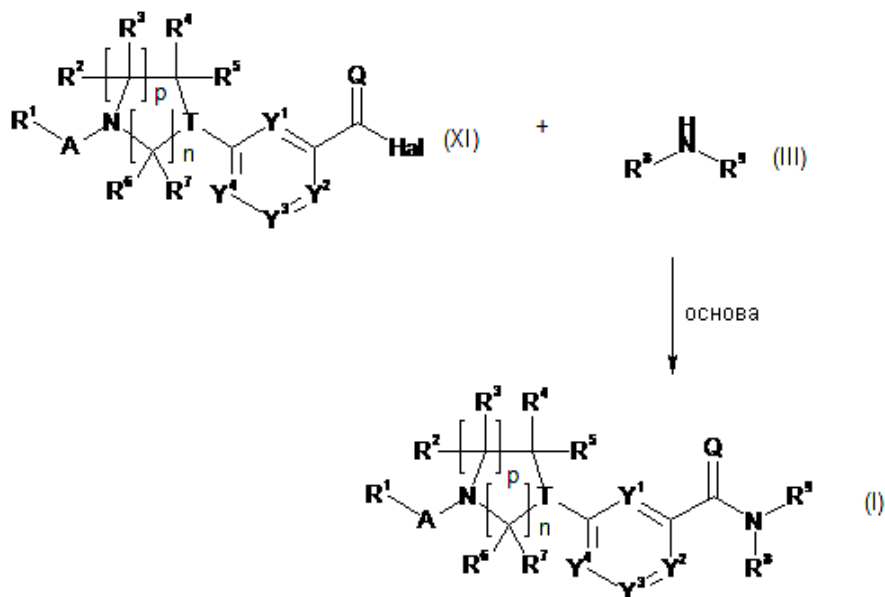
Альтернативно, сполуки формули V, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , A, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, можна одержати шляхом перетворення сполуки формули X, де R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , A, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, за допомогою сполуки формули IX, де R^1 та A є такими, як визначено для формули I, і R^{29} являє собою гідроксі або галоген, переважно фтор, хлор або бром, та реагенту, що утворює пептидний зв'язок, або основи, такої як піридин, триетиламін, етилдіізопропіламін тощо. Це зображено на схемі 6.

Схема 6



Альтернативно, сполуки формули I, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, можна одержати шляхом перетворення сполуки формули XI, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і Hal являє собою галоген, переважно фтор, хлор або бром, за допомогою сполуки формули III, де R^8 та R^9 є такими, як визначено для формули I, і основи, такої як піридин, триетиламін, етилдіізопропіламін тощо. Це зображено на схемі 7.

Схема 7

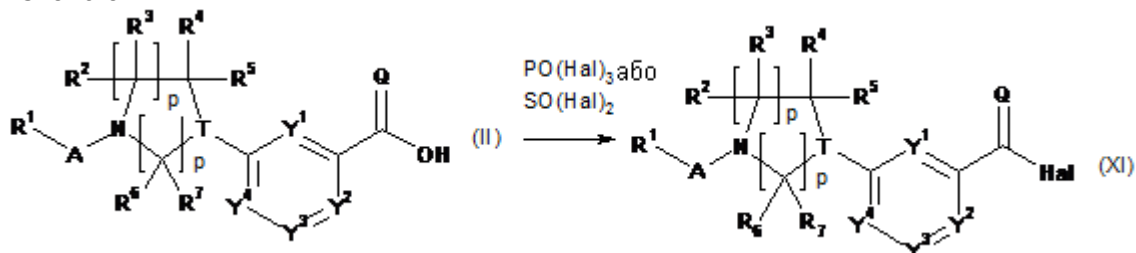


Сполуки формули XI, де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p та Q є такими, як визначено для формули I, і Hal являє собою галоген, переважно фтор, хлор або бром, можна

одержати шляхом перетворення сполуки формули II, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, n, p$ та Q є такими, як визначено для формули I, за допомогою фосфорилгалогеніду, такого як фосфорилхлорид або фосфорилбромід, або тіонілгалогеніду, такого як тіонілхлорид або тіонілбромід. Це зображено на схемі 8.

5

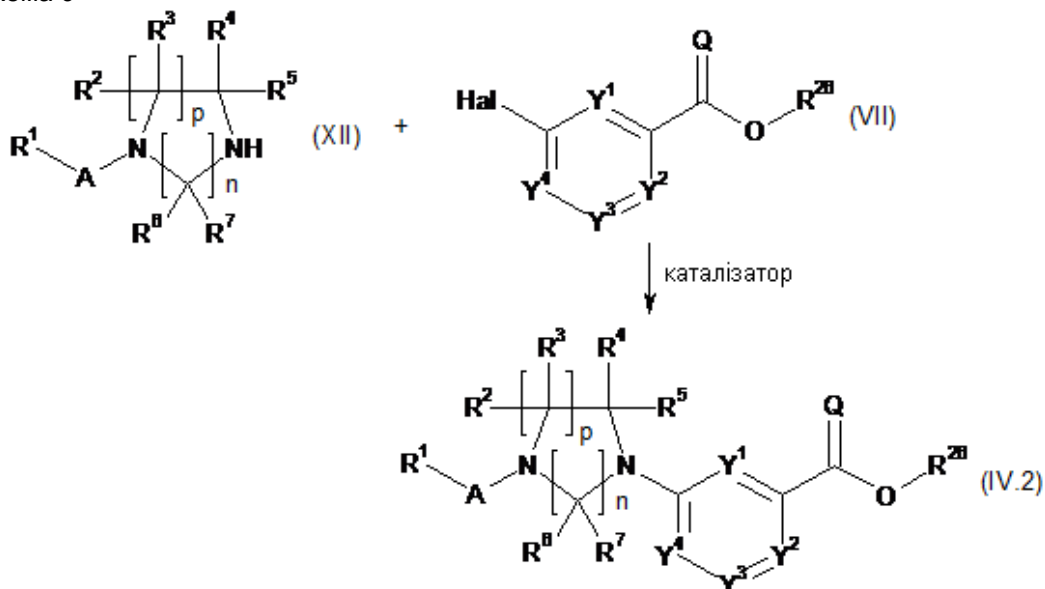
Схема 8



Сполуки формули IV.2, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, n, p$ та Q є такими, як визначено для формули I, і R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, можна одержати шляхом перетворення сполуки формули XII, де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, n, p$ та A є такими, як визначено для формули I, за допомогою сполуки формули VII, де Y^1, Y^2, Y^3, Y^4 та Q є такими, як визначено для формули I, R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил, а Hal являє собою галоген, переважно йод, бром або хлор. Це зображено на схемі 9.

15

Схема 9



На подив, у даний час було виявлено, що нові сполуки формули I мають, для практичних цілей, досить ефективний рівень біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинюваних грибами.

Сполуки формули I можна застосовувати в сільському господарстві та пов'язаних з ним галузях застосування, наприклад, як активні інгредієнти для боротьби зі шкідниками рослин або на неживих матеріалах для боротьби із мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини. Нові сполуки відрізняються чудовою активністю за низьких рівнів застосування, при цьому вони добре переносяться рослинами і є безпечними для довкілля. Вони характеризуються дуже корисними лікувальними, профілактичними та системними властивостями, та їх можна застосовувати для захисту численних культурних рослин. Сполуки формули I можна застосовувати для пригнічення або знищення шкідників, які трапляються на рослинах або частинах рослин (плоді, квітках, листі, стеблах, бульбах, корінні) або різних культурах корисних рослин, при цьому в той самий час захищаючи ті частини рослини, які виростають пізніше, наприклад, від фітопатогенних мікроорганізмів.

30

Також можливе застосування сполук формули I як засобів для протруювання з метою

обробки матеріалу для розмноження рослин, наприклад, насіння, наприклад, плодів, бульб, або зерна, або живців рослини (наприклад, рису), для захисту від грибкових інфекцій, а також від фітопатогенних грибків, що трапляються в ґрунті. Матеріал для розмноження можна обробити композицією, яка містить сполуку формули I, перед садінням: насіння, наприклад, можна протруїти перед висіванням. Активні інгредієнти за даним винаходом також можна застосовувати стосовно до зерна (у формі покриття), або шляхом просочування насіння водним складом, або шляхом покривання їх складом твердих речовин. Композицію також можна застосовувати стосовно до місця садіння під час садіння матеріалу для розмноження, наприклад, стосовно до борозни для насіння під час висівання. Даний винахід також стосується таких способів обробки матеріалу для розмноження рослин та обробленого у такий спосіб матеріалу для розмноження рослин.

Крім того, сполуки за даним винаходом можна застосовувати для боротьби із грибками в суміжних галузях, наприклад, під час захисту технічних матеріалів, у тому числі дерев'яних та пов'язаних з деревом технічних продуктів, під час зберігання продуктів, під час організації санітарної обробки.

Крім того, даний винахід можна застосовувати для захисту неживих матеріалів від ураження грибками, наприклад, пиломатеріалів, лицювальних плит та фарби.

Сполуки формули I, наприклад, є ефективними проти фітопатогенних грибів наступних класів: Fungi imperfecti (наприклад, *Alternaria* spp.), Basidiomycetes (наприклад, *Corticium* spp., *Ceratobasidium* spp., *Waitea* spp., *Thanatephorus* spp., *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.), Ascomycetes (наприклад, *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Erysiphe* spp., *Podosphaera* spp., *Uncinula* spp., *Monilinia* spp., *Sclerotinia* spp., *Colletotrichum* spp., *Glomerella* spp., *Fusarium* spp., *Gibberella* spp., *Monographella* spp., *Phaeosphaeria* spp., *Mycosphaerella* spp., *Cercospora* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium* spp., *Magnaporthe* spp., *Gaeumannomyces* spp., *Oculimacula* spp., *Ramularia* spp., *Botryotinia* spp.) та Oomycetes (наприклад, *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Peronospora* spp., *Pseudoperonospora* spp., *Bremia* spp). Помітна активність спостерігається стосовно несправжньої борошнистої роси (наприклад, *Plasmopara viticola*) та фітофторозу пасльонових (наприклад, *Phytophthora infestans*). Крім того, нові сполуки формули I ефективні стосовно фітопатогенних грамнегативних бактерій (наприклад, *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia amilovor*a, *Ralstonia* spp.) та вірусів (наприклад, вірусу тютюнової мозаїки).

В обсязі даного винаходу цільові культури та/або корисні рослини, що підлягають захисту, як правило, включають наступні види рослин: злакові (пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, маїс, сорго та споріднені види); буряк (цукровий буряк та кормовий буряк); зерняткові, кістянкові та кущові плодові або ягідні культури (види яблуні, груші, сливи, персика, мигдалю, вишні, полуниці, малини та ожини); бобові рослини (боби, сочевиця, горох, соя); олійні рослини (рапс, гірчиця, мак, види оливи, види соняшника, кокосова пальма, рослини ріцини, какао, арахіс); огіркові рослини (види гарбуза, огірка, дині); волокнисті рослини (бавовник, льон, конопля, джут); цитрусові рослини (апельсин, лимон, грейпфрут, мандарин); овочі (шпинат, латук, спаржа, види капусти, види моркви, види цибулі, томат, картопля, паприка); лаврові (авокадо, кориця, камфорне дерево) або такі рослини, як тютюн, горіхи, кавове дерево, баклажани, цукрова тростина, чай, перець, види винограду, хміль звичайний, види бананів та рослини-джерела натурального каучуку, а також газонні і декоративні рослини.

Корисні рослини та/або цільові культури згідно з даним винаходом включають традиційні, а також генетично поліпшені або сконструйовані сорти, такі як, наприклад, стійкі до ураження комахами-шкідниками (наприклад, сорти Bt. та VIP), а також стійкі до захворювань, стійкі до гербіцидів (наприклад, стійкі до гліфосату та глюфосинату сорти маїсу, комерційно доступні за торговельними назвами RoundupReady® та LibertyLink®) та стійкі до ураження нематодами сорти. Наприклад, корисні генетично поліпшені або сконструйовані сорти сільськогосподарських культур включають сорти бавовнику Stoneville 5599BR та Stoneville 4892BR.

Термін "корисні рослини" та/або "цільові сільськогосподарські культури" слід розуміти як такий, що також включає корисні рослини, яким надали стійкості до гербіцидів, таких як бромексиніл, або класів гербіцидів (таких як, наприклад, інгібітори HPPD, інгібітори ALS, наприклад, примісульфурон, просульфурон та трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енолпіровілішкімат-3-фосфатсинтази), інгібітори GS (глутамінсинтази)) у результаті здійснення традиційних способів розведення або генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури, якій надали стійкості до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу, за допомогою традиційних способів розведення (мутагенезу) є суріпиця Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким надали стійкості до гербіцидів або класів гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають стійкі до гліфосату та глюфосинату сорти

маїсу, комерційно доступні за торговельними назвами RoundupReady®, Herculex I® та LibertyLink®.

Термін "корисні рослини" та/або "цільові сільськогосподарські культури" слід розуміти як такий, що також включає корисні рослини, трансформовані за допомогою застосування технологій рекомбінантних ДНК таким чином, що вони стали здатними синтезувати один або декілька токсинів селективної дії, таких як відомі, наприклад, у токсиноутворювальних бактерій, особливо таких з роду *Bacillus*.

Термін "корисні рослини" та/або "цільові сільськогосподарські культури" слід розуміти як такий, що також включає корисні рослини, які змінили шляхом застосування технологій рекомбінантних ДНК таким чином, що вони здатні синтезувати антипатогенні речовини, що мають селективну дію, такі як, наприклад, так звані "білки, пов'язані з патогенезом" (PRP, див., наприклад, EP-A-0392225). Приклади таких антипатогенних речовин і трансгенних рослин, здатних синтезувати такі антипатогенні речовини, відомі, наприклад, з EP-A-0392225, WO 95/33818 та EP-A-0353191. Способи одержання таких трансгенних рослин у цілому відомі фахівцям в даній галузі та описані, наприклад, у публікаціях, згаданих вище.

Термін "місце зростання", застосовуваний в даному документі, призначений охоплювати місце, на якому зростають рослини, на яке висівають рослинний матеріал для розмноження рослин або на якому поміщають рослинний матеріал в ґрунт для розмноження рослин. Прикладом такого місця зростання є поле, на якому зростають культурні рослини.

Термін "рослинний матеріал для розмноження" розуміють як такий, що позначає генеративні частини рослин, такі як насіння, які можна застосовувати для розмноження останніх, та вегетативний матеріал, такий як живці або бульби, наприклад, картоплі. Можна згадати, наприклад, насіння (у точному значенні), коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища та частини рослин. Також можна згадати пророслі рослини та молоді рослини, які слід пересадити після проростання або після появи сходів із ґрунту. Ці сіянці можна захистити до пересадження за допомогою повної або часткової обробки шляхом занурення. Переважно, "рослинний матеріал для розмноження" слід розуміти як такий, що означає насіння.

Сполуки формули I можна застосовувати в немодифікованій формі або, переважно, разом з допоміжними засобами, традиційно застосовуваними в галузі одержання складів. Із цією метою їх традиційно можна складати у відомий спосіб в емульговані концентрати, покривні пасти, розчини або суспензії, які безпосередньо розпорошуються або розводяться, розведені емульсії, змочувані порошки, розчинні порошки, дисти, грануляти, а також інкапсульовані форми, наприклад, у полімерних речовинах. Як і у випадку з типом композицій, способи застосування, такі як розпилення, тонке розпилення, запилення, розсіювання, нанесення покриття або полив, обирають відповідно до передбачуваних цілей та переважних умов. Композиції також можуть містити додаткові допоміжні засоби, такі як стабілізатори, протиспінювачі, регулятори в'язкості, зв'язувальні речовини або речовини для підвищення клейкості, а також добрива, донори мікроелементів або інші складові для одержання окремих ефектів.

Придатні носії та допоміжні засоби, наприклад, для застосування у сільському господарстві, можуть бути твердими або рідкими та являти собою речовини, придатні в технології одержання складів, наприклад, природні або регенеровані мінеральні речовини, розчинники, диспергувальні засоби, змочувальні засоби, речовини для підвищення клейкості, зв'язувальні речовини або добрива. Такі носії, наприклад, описані в WO 97/33890.

Сполуки формули I можна застосовувати у формі композицій та можна вносити на посівну площу або рослину, що підлягають обробці, одночасно або послідовно з додатковими сполуками. Ці додаткові сполуки можуть являти собою, наприклад, добрива, або донори мікроелементів, або інші препарати, які впливають на зростання рослин. Вони також можуть являти собою селективні гербіциди або неселективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематодіциди, молюскоциди або суміші деяких із цих препаратів, за бажання разом з додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами або допоміжними засобами, що полегшують застосування, звичайно застосовуваними в галузі одержання складів.

Сполуки формули I звичайно застосовують у формі фунгіцидних композицій для боротьби з фітопатогенними мікроорганізмами або захисту від них, які містять як активний інгредієнт щонайменше одну сполуку формули I або щонайменше одну згадану вище переважну окрему сполуку, у вільній формі або у формі агрохімічно застосовної солі, та щонайменше один з вищезгаданих допоміжних засобів.

Даний винахід стосується фунгіцидної композиції, яка містить щонайменше одну сполуку формули I, носій, прийнятний з погляду сільського господарства, та необов'язково допоміжний засіб. Носій, прийнятний з погляду сільського господарства, являє собою, наприклад, носій, придатний для застосування у сільському господарстві. Сільськогосподарські носії добре відомі

з рівня техніки. Переважно, зазначені фунгіцидні композиції можуть містити, окрім сполуки формули I, додатковий фунгіцидний активний інгредієнт.

Сполука формули (I) може бути єдиним активним інгредієнтом композиції, або за необхідності вона може бути змішана з одним або декількома додатковими активними інгредієнтами, такими як інсектицид, фунгіцид, синергіст, гербіцид або регулятор росту рослин. Додатковий активний інгредієнт може, у деяких випадках, зумовлювати появу несподіваних синергічних активностей. Приклади придатних додаткових активних інгредієнтів включають наступні: азоксистробін (131860-33-8), димоксистробін (149961-52-4), енестробін (238410-11-2), флуоксастробін (193740-76-0), крезоксим-метил (143390-89-0), метоміностробін (133408-50-1), оризастробін (248593-16-0), пікоксистробін (117428-22-5), піраклостробін (175013-18-0), азаконазол (60207-31-0), бромуконазол (116255-48-2), ципроконазол (94361-06-5), дифеноконазол (119446-68-3), диніконазол (83657-24-3), диніконазол-М (83657-18-5), епоксиконазол (13385-98-8), фенбуконазол (114369-43-6), флухіконазол (136426-54-5), флузілазол (85509-19-9), флутриафол (76674-21-0), гексаконазол (79983-71-4), імазаліл (58594-72-2), імібенконазол (86598-92-7), іпконазол (125225-28-7), метконазол (125116-23-6), міклобутаніл (88671-89-0), окспоконазол (174212-12-5), пефуразоат (58011-68-0), пенконазол (66246-88-6), прохлораз (67747-09-5), пропіконазол (60207-90-1), протіконазол (178928-70-6), симеконазол (149508-90-7), тебуконазол (107534-96-3), тетраконазол (112281-77-3), триадімефон (43121-43-3), триадіменол (55219-65-3), трифлумізол (99387-89-0), тритиконазол (131983-72-7), диклобутразол (76738-62-0), етаконазол (60207-93-4), флуконазол (86386-73-4), флуконазол-цис (112839-32-4), тіабендазол (148-79-8), квінконазол (103970-75-8), фенпіклоніл (74738-17-3), флудіоксоніл (131341-86-1), ципродиніл (121552-61-2), мепаніпірим (110235-47-7), піриметаніл (53112-28-0), алдиморф (91315-15-0), додеморф (1593-77-7), фенпропіморф (67564-91-4), тридеморф (81412-43-3), фенпропідин (67306-00-7), спіроксамін (118134-30-8), ізопіразам (881685-58-1), седаксан (874967-67-6), біксафен (581809-46-3), пентіопірад (183675-82-3), флуксапіроксад (907204-31-3), боскалід (188425-85-6), пенфлуфен (494793-67-8), флуопірам (658066-35-4), мандипропамід (374726-62-2), бентіавалікарб (413615-35-7), диметоморф (110488-70-5), хлорталоніл (1897-45-6), флуазинам (79622-59-6), дитіанон (3347-22-6), метрафенон (220899-03-6), трициклазол (41814-78-2), мефеноксам (70630-17-0), металаксил (57837-19-1), ацибензолар (126448-41-7) (ацибензолар-s-метил (126448-41-7)), манкозєб (8018-01-7), аметоктрадин (865318-97-4) цифлуфенамід (180409-60-3), іпконазол (125225-28-7), амисулбром (348635-87-0), етабоксам (16650-77-3), флюопіколід (239110-15-7), флутіаніл (304900-25-2), ізотіаніл (224049-04-1), проквіназид (189278-12-4), валіфенал (283159-90-0), 1-метилциклопропен (3100-04-7), трифлуксистробін (141517-21-7), сірка (7704-34-9), карбонат міді-амонію (CAS 33113-08-5); олеат міді (CAS 1120-44-1); фолпет (133-07-3), квіноксифен (124495-18-7), каптан (133-06-2), фенгексамід (126833-17-8), глюфосинат та його солі (51276-47-2, 35597-44-5 (S-ізомер)), гліфосат (1071-83-6) та його солі (69254-40-6 (діамонію), 34494-04-7 (диметиламонію), 38641-94-0 (ізопропіламонію), 40465-66-5 (моноамонію), 70901-20-1 (калію), 70393-85-0 (сесквінатрію), 81591-81-3 (тримезієва)), (2-дихлорметилєн-3-етил-1-метиліндан-4-іл)-амід 1-метил-3-дифторметил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти, (4'-метилсульфанілдифеніл-2-іл)-амід 1-метил-3-дифторметил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти, [2-(2,4-дихлорфеніл)-2-метокси-1-метилетил]-амід 1-метил-3-дифторметил-4Н-піразол-4-карбонової кислоти, (5-хлор-2,4-диметилпіридин-3-іл)-(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)-метанон, (5-бром-4-хлор-2-метоксипіридин-3-іл)-(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)-метанон, 2-{2-[(E)-3-(2,6-дихлорфеніл)-1-метилпроп-2-єн-(E)-іліденамінооксиметил]-феніл}-2-[(Z)-метоксііміно]-N-метилацетамід, 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметилізоксазолідин-3-іл]-піридин.

Інший аспект даного винаходу пов'язаний із застосуванням сполуки формули I або наведеної вище переважної окремої сполуки, композиції, яка містить щонайменше одну сполуку формули I або щонайменше одну наведену вище переважну окрему сполуку, або фунгіцидної суміші, яка містить щонайменше одну сполуку формули I або щонайменше одну наведену вище окрему сполуку, у суміші з описаними вище іншими фунгіцидами для боротьби із зараженням або попередження зараження рослин, наприклад, корисних рослин, таких як сільськогосподарські культури, матеріал для їхнього розмноження, наприклад, насіння, зібрані культури, наприклад, зібрані продовольчі культури, або неживих матеріалів, фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибовими організмами.

Наступний аспект даного винаходу пов'язаний зі способом боротьби із зараженням або попередження зараження рослин, наприклад, корисних рослин, таких як сільськогосподарські культури, матеріал для їхнього розмноження, наприклад, насіння, зібрані культури, наприклад, зібрані продовольчі культури, або неживих матеріалів, фітопатогенними мікроорганізмами, або

мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини, особливо грибовими організмами, який включає застосування сполуки формули I або згаданої вище переважної окремої сполуки як активного інгредієнта стосовно рослин, частин рослин або місця їх зростання, матеріалу для їхнього розмноження або будь-якої частини неживих матеріалів.

Боротьба або попередження означають зменшення зараження фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини, особливо грибовими організмами, до такого рівня, щоб було видно поліпшення.

Переважним способом боротьби із зараженням або попередження зараження сільськогосподарських культур фітопатогенними мікроорганізмами, особливо грибовими мікроорганізмами, який включає застосування сполуки формули I, або агрохімічної композиції, яка містить щонайменше одну із зазначених сполук, є некореневе внесення. Частота внесення та норма внесення будуть залежати від ризику зараження відповідним патогеном. Проте, сполуки формули I можуть також проникати в рослину крізь коріння з ґрунту (системна дія) завдяки зрошенню місця зростання рослини рідким складом або завдяки застосуванню сполук у твердій формі стосовно ґрунту, наприклад, у гранульованій формі (внесення в ґрунт). У культур водяного рису такі грануляти можна застосовувати стосовно залитого рисового поля. Сполуки формули I можна також застосовувати стосовно насіння (нанесення покриття) або шляхом просочування насіння або бульб рідкою сполукою фунгіциду, або шляхом покривання їх складом твердих речовин.

Склад, наприклад, композиція, яка містить сполуку формули I та за необхідності твердий або рідкий допоміжний засіб або мономери для інкапсуляції сполуки формули I, можна одержати у відомий спосіб, як правило, шляхом ретельного перемішування та/або розмелювання сполуки з наповнювачами, наприклад, розчинниками, твердими носіями та необов'язково поверхнево-активними сполуками (поверхнево-активними речовинами).

Агрохімічні сполуки та/або композиції зазвичай будуть містити від 0,1 до 99 % за вагою, переважно від 0,1 до 95 % за вагою сполуки формули I, 99,9-1 % за вагою, переважно 99,8-5 % за вагою твердого або рідкого допоміжного засобу та від 0 до 25 % за вагою, переважно від 0,1 до 25 % за вагою поверхнево-активної речовини.

Переважні норми внесення звичайно складають від 5 г до 2 кг активного інгредієнта (а.і.) на гектар (га), переважно від 10 г до 1 кг а.і./га, найпереважніше від 20 г до 600 г а.і./га. У разі застосування щодо насіння засобу для зрошення традиційні дозування складають від 10 мг до 1 г активної речовини на кг насіння.

Оскільки переважно складати комерційні продукти у формі концентратів, кінцевий споживач буде звичайно застосовувати розведені сполуки.

Наступний необмежувальний приклад детально ілюструє описаний вище даний винахід.

Приклад 1. Даний приклад ілюструє одержання 3-{4-[2-(3,5-біс-дифторметилпіразол-1-іл)-ацетил]-піперазин-1-іл}-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензаміду (сполука № I.z.001).

а) Одержання трет-бутилового ефіру 4-{3-[(R)-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-іл)карбамоїл]-феніл}-піперазин-1-карбонової кислоти

НАТУ (6,6 г, 14,4 ммоль) та етилдіізопропіламін (4,1 г, 26 ммоль) послідовно додавали до суспензії трет-бутилового ефіру 4-(3-карбоксифеніл)-піперазин-1-карбонової кислоти (4,0 г, 13 ммоль) в 30 мл N, N-диметилформаміду. Дану суміш перемішували протягом 10 хвилин за кімнатної температури, потім додавали розчин R-(-)-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафтиламіну (1,9 г, 13 ммоль) в 20 мл N, N-диметилформаміду. Реакційну суміш перемішували протягом 4 годин за кімнатної температури. Після цього розчинник видаляли in vacuo, олію, що залишилася, розчиняли в етилацетаті і промивали насиченим водним розчином бікарбонату натрію, 0,5 N соляною кислотою та сольовим розчином. Органічний шар сушили над сульфатом натрію і випарювали, залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 3:7) з одержанням трет-бутилового ефіру 4-{3-[(R)-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-іл)карбамоїл]-феніл}-піперазин-1-карбонової кислоти. $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): = 1,51 (s, 9H), 1,86-1,95 (m, 2H), 2,02-2,16 (m, 2H), 2,82-2,91 (m, 2H), 3,20 (t, 4H), 3,61 (t, 4H), 5,37 (t, 1H), 7,12-7,19 (m, 4H), 7,26 (q, 1H), 7,37 (t, 2H), 7,48 (d, 1H), 8,69 (bs, 1H). MS: m/z=436 (M+1).

б) Одержання 3-піперазин-1-іл-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензаміду

До розчину трет-бутилового ефіру 4-{3-[(R)-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-іл)карбамоїл]-феніл}-піперазин-1-карбонової кислоти (5,7 г, 13 ммоль) в 150 мл діоксану додавали 33 мл 4 N соляної кислоти. Реакційну суміш перемішували протягом 16 годин за кімнатної температури. Після цього розчинник видаляли in vacuo, осад розчиняли в етилацетаті та промивали

насиченим водним розчином бікарбонату натрію. Органічний шар сушили над карбонатом калію та випарювали, одержуючи 3-піперазин-1-іл-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензамід, який був досить чистим для перетворення на наступному етапі без додаткового очищення. ¹H-ЯМР (400 МГц, MeOD): δ = 1,83-1,92 (m, 2H), 2,02 (q, 1H), 2,13 (q, 1H), 2,83-2,89 (m, 2H), 3,00 (t, 4H), 3,21 (t, 4H), 5,34 (t, 1H), 7,11-7,19 (m, 4H), 7,27 (q, 1H), 7,34 (d, 2H), 7,48 (d, 1H). MS: m/z=336 (M+1).

с) Одержання 3-{4-[2-(3,5-бісдифторметилпіразол-1-іл)-ацетил]-піперазин-1-іл}-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензаміду (сполуки № I.z.001)

До розчину 2-[3,5-біс(дифторметил)піразол-1-іл]оцтової кислоти (0,1 г, 0,5 ммоль) в 5 мл дихлорметану додавали за кімнатної температури одну краплину N, N-диметилформаміду, потім оксалілхлорид (0,07 г, 0,6 ммоль). Дану суміш перемішували протягом 15 хвилин за кімнатної температури, а потім випарювали. Залишок повторно розчиняли в 5 мл дихлорметану та повільно додавали за 0 °C до розчину 3-піперазин-1-іл-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензаміду (0,2 г, 0,5 ммоль) і триетиламіну (0,3 г, 2,7 ммоль) в 5 мл дихлорметану. Реакційну суміш перемішували протягом 2 годин за кімнатної температури, потім розводили водою та дихлорметаном. Органічний шар промивали водою, 1 Н соляною кислотою та сольовим розчином, сушили над сульфатом натрію та випарювали. Залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 3:7) з одержанням 3-{4-[2-(3,5-біс-дифторметилпіразол-1-іл)-ацетил]-піперазин-1-іл}-N-(R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілбензаміду (сполуки № I.z.001). ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ=1,62 (t, 1H), 1,79-1,90 (m, 2H), 2,07 (q, 1H), 2,75 (q, 2H), 3,19 (s, 2H), 3,24 (s, 2H), 3,60 (s, 2H), 3,72 (s, 2H), 5,08 (s, 2H), 5,31 (q, 1H), 6,26 (d, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,97 (q, 1H), 7,04-7,13 (m, 3H), 7,22 (t, 2H), 7,40 (s, 1H). MS: m/z=544 (M+1).

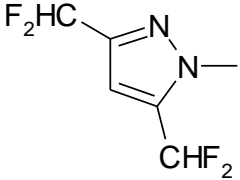
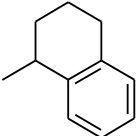
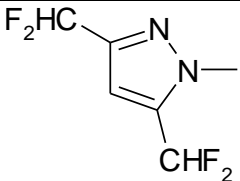
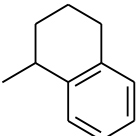
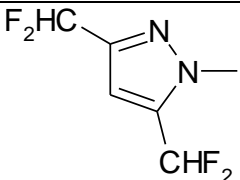
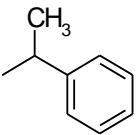
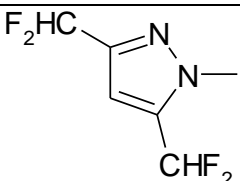
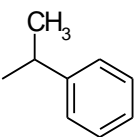
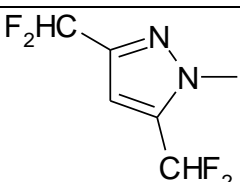
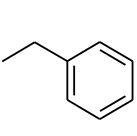
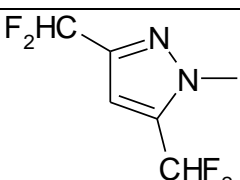
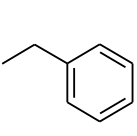
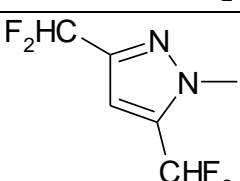
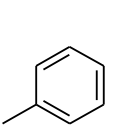
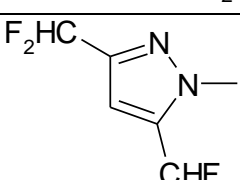
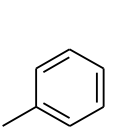
Наведена нижче таблиця 1 ілюструє приклади окремих сполук формули I за даним винаходом.

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

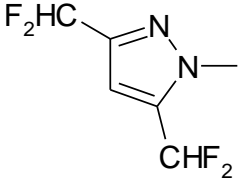
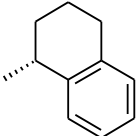
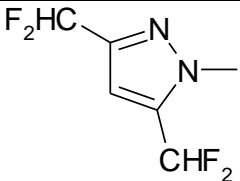
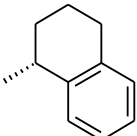
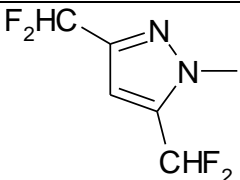
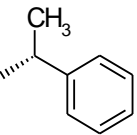
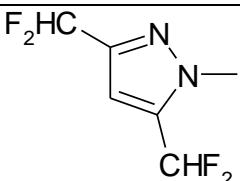
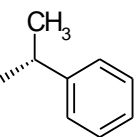
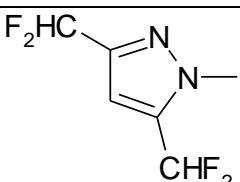
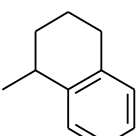
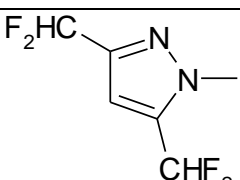
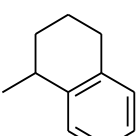
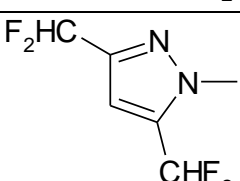
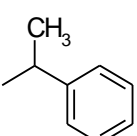
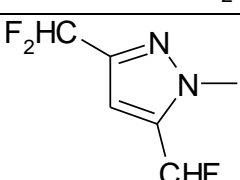
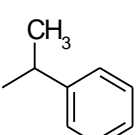
Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
1		-CH ₂ C(=O)-	O	
2		-CH ₂ C(=O)-	S	
3		-CH ₂ C(=O)-	O	
4		-CH ₂ C(=O)-	S	

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
5		-CH ₂ C(=O)-	O	
6		-CH ₂ C(=O)-	S	
7		-CH ₂ C(=O)-	O	
8		-CH ₂ C(=O)-	S	
9		-CH ₂ C(=O)-	O	
10		-CH ₂ C(=O)-	S	
11		-CH ₂ C(=O)-	O	
12		-CH ₂ C(=O)-	S	

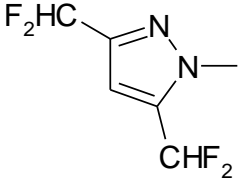
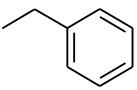
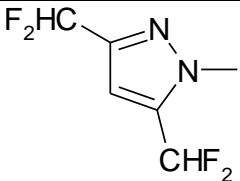
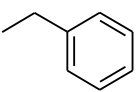
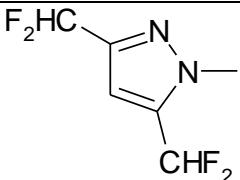
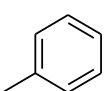
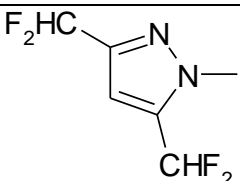
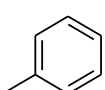
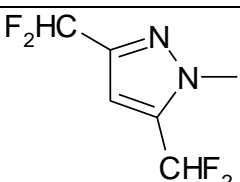
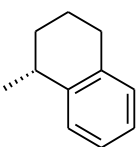
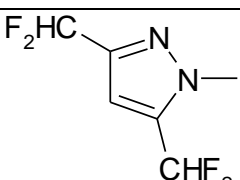
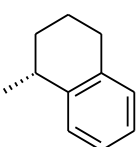
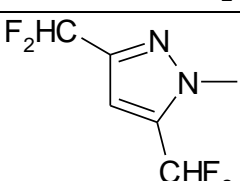
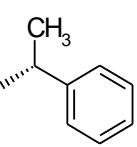
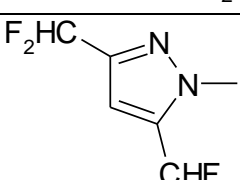
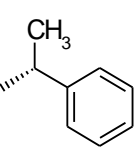
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

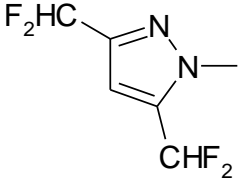
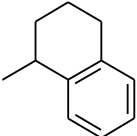
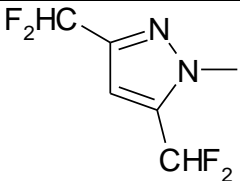
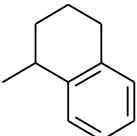
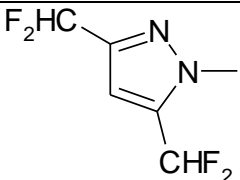
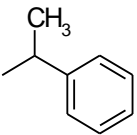
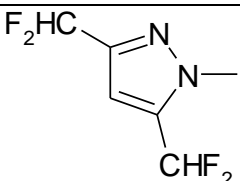
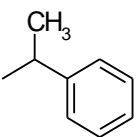
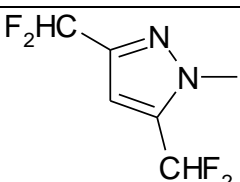
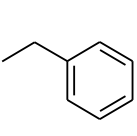
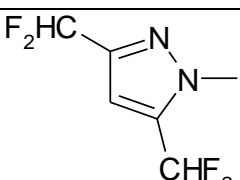
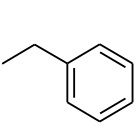
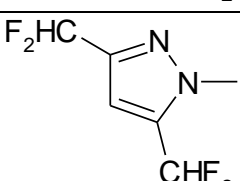
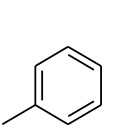
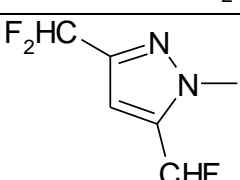
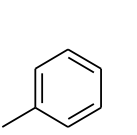
Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
13		-CH ₂ C(=S)-	O	
14		-CH ₂ C(=S)-	S	
15		-CH ₂ C(=S)-	O	
16		-CH ₂ C(=S)-	S	
17		-CH ₂ C(=S)-	O	
18		-CH ₂ C(=S)-	S	
19		-CH ₂ C(=S)-	O	
20		-CH ₂ C(=S)-	S	

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

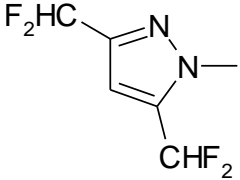
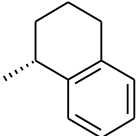
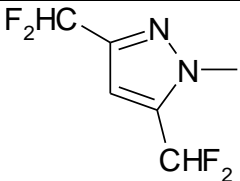
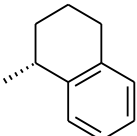
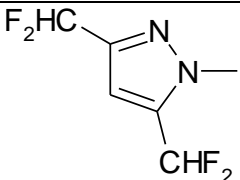
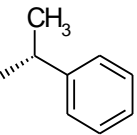
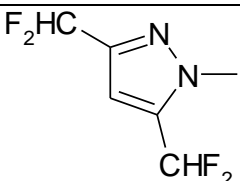
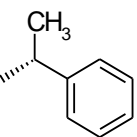
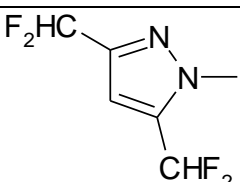
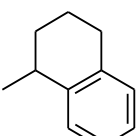
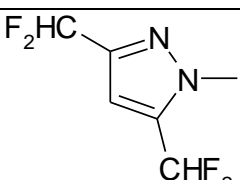
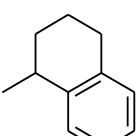
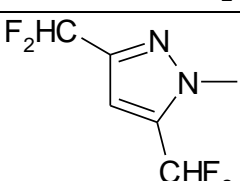
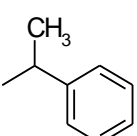
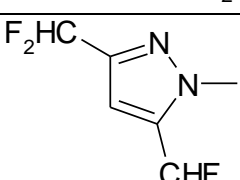
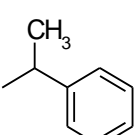
Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
21		-CH ₂ C(=S)-	O	
22		-CH ₂ C(=S)-	S	
23		-CH ₂ C(=S)-	O	
24		-CH ₂ C(=S)-	S	
25		-OC(=O)-	O	
26		-OC(=O)-	S	
27		-OC(=O)-	O	
28		-OC(=O)-	S	

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
29		-OC(=O)-	O	
30		-OC(=O)-	S	
31		-OC(=O)-	O	
32		-OC(=O)-	S	
33		-OC(=O)-	O	
34		-OC(=O)-	S	
35		-OC(=O)-	O	
36		-OC(=O)-	S	

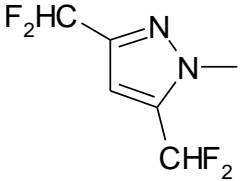
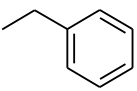
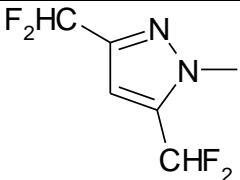
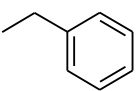
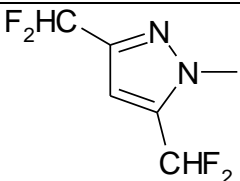
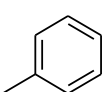
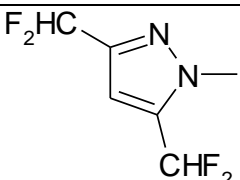
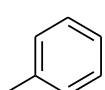
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
37		-CH ₂ SO ₂ -	O	
38		-CH ₂ SO ₂ -	S	
39		-CH ₂ SO ₂ -	O	
40		-CH ₂ SO ₂ -	S	
41		-CH ₂ SO ₂ -	O	
42		-CH ₂ SO ₂ -	S	
43		-CH ₂ SO ₂ -	O	
44		-CH ₂ SO ₂ -	S	

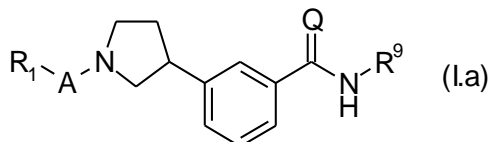
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I за даним винаходом

Сполука №	R1	A	Q	R ⁹
45		-CH ₂ SO ₂ -	O	
46		-CH ₂ SO ₂ -	S	
47		-CH ₂ SO ₂ -	O	
48		-CH ₂ SO ₂ -	S	

де

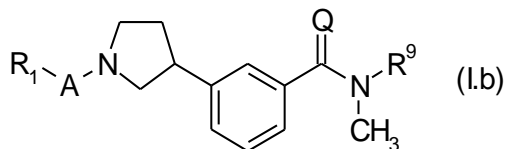
а) 48 сполук формули (I.a):



5

де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;

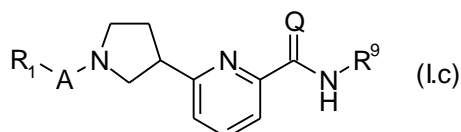
б) 48 сполук формули (I.b):



10

де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;

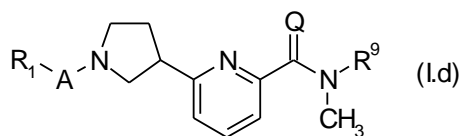
с) 48 сполук формули (I.c):



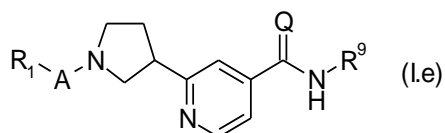
15

де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;

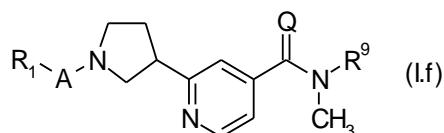
d) 48 сполук формули (I.d):



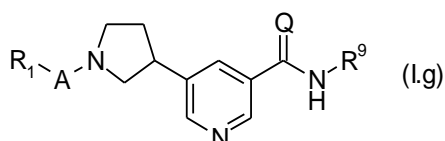
5 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
е) 48 сполук формули (I.e):



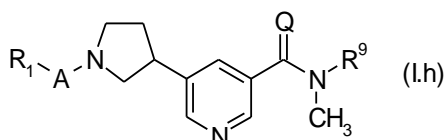
10 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
f) 48 сполук формули (I.f):



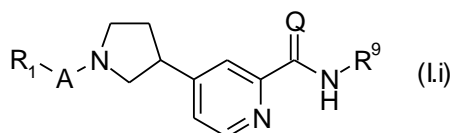
15 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
g) 48 сполук формули (I.g):



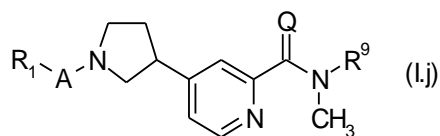
20 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
h) 48 сполук формули (I.h):



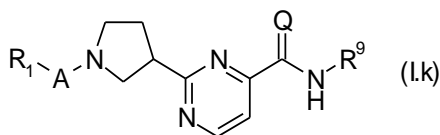
25 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
і) 48 сполук формули (I.i):



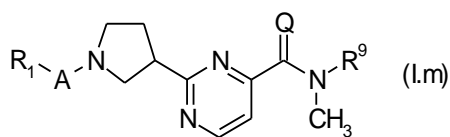
30 де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
j) 48 сполук формули (I.j):



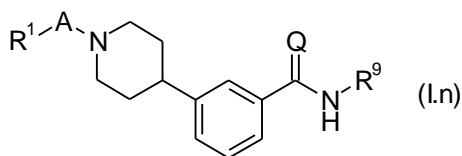
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
к) 48 сполук формули (l.k):



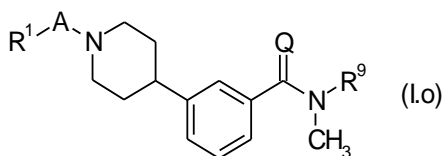
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
м) 48 сполук формули (l.m):



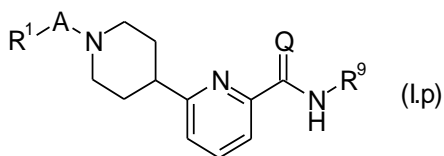
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
н) 48 сполук формули (l.n):



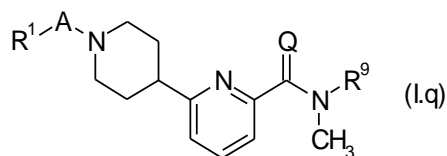
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
о) 48 сполук формули (l.o):



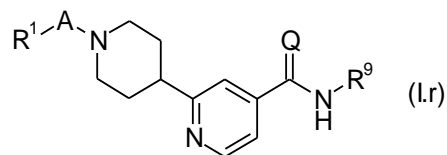
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
р) 48 сполук формули (l.p):



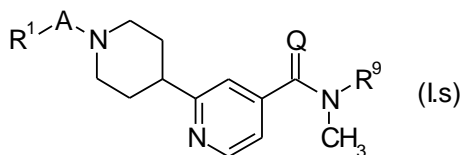
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
q) 48 сполук формули (l.q):



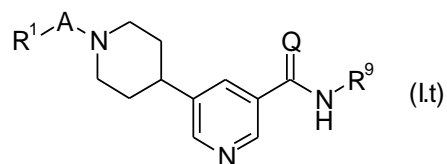
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
г) 48 сполук формули (l.r):



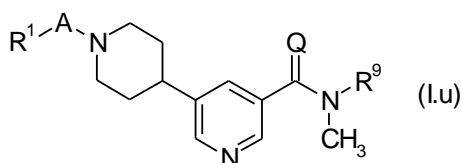
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
с) 48 сполук формули (l.s):



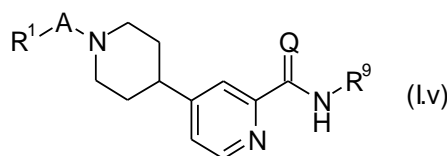
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
t) 48 сполук формули (l.t):



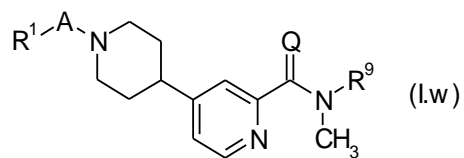
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
u) 48 сполук формули (l.u):



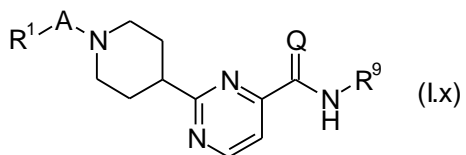
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
v) 48 сполук формули (l.v):



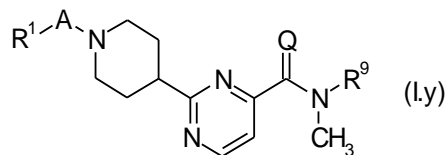
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
w) 48 сполук формули (l.w):



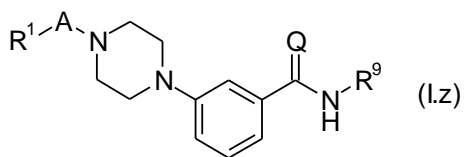
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
х) 48 сполук формули (I.x):



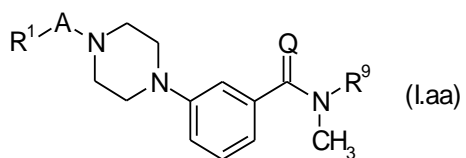
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
у) 48 сполук формули (I.y):



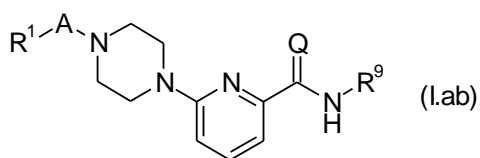
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
z) 48 сполук формули (I.z):



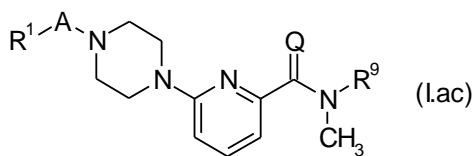
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
аа) 48 сполук формули (I.aa):



де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
аб) 48 сполук формули (I.ab):

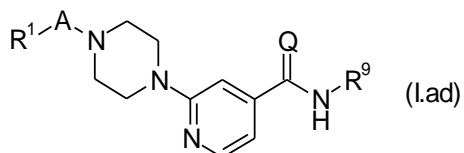


де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ас) 48 сполук формули (I.ac):



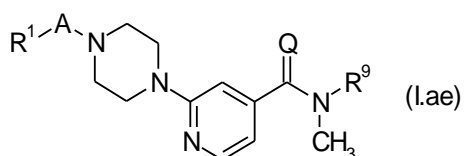
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ad) 48 сполук формули (I.ad):

5



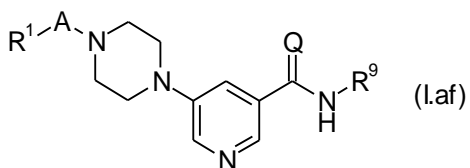
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ae) 48 сполук формули (I.ae):

10



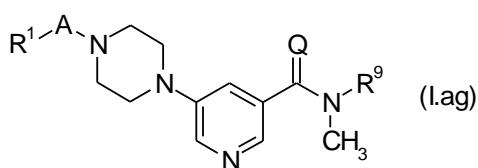
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
af) 48 сполук формули (I.af):

15



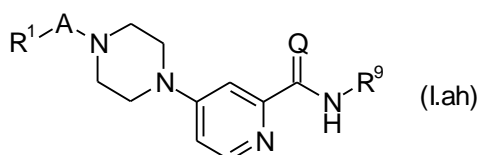
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ag) 48 сполук формули (I.ag):

20



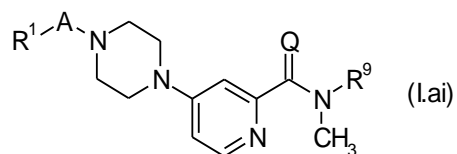
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ah) 48 сполук формули (I.ah):

25



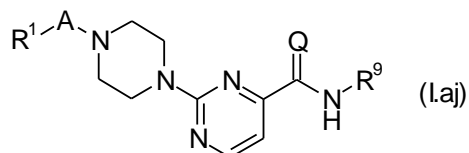
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ai) 48 сполук формули (I.ai):

30



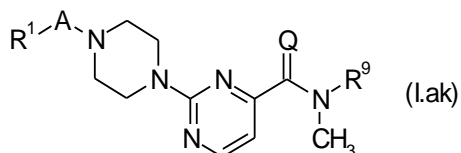
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
aj) 48 сполук формули (I.ai):

5



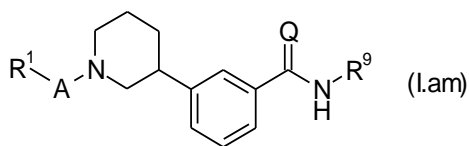
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ak) 48 сполук формули (I.ak):

10



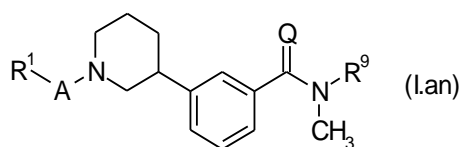
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
am) 48 сполук формули (I.am):

15



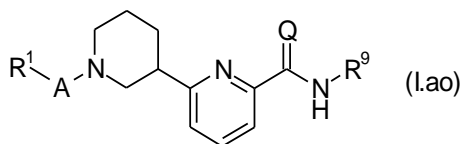
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
an) 48 сполук формули (I.an):

20



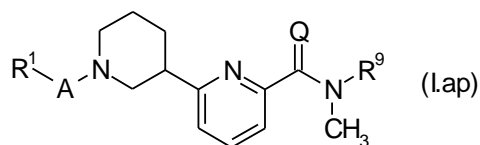
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ao) 48 сполук формули (I.ao):

25



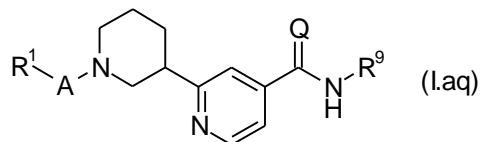
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ap) 48 сполук формули (I.ap):

30



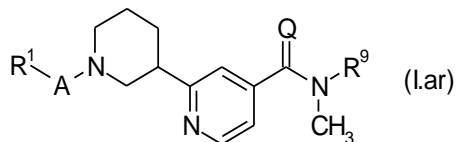
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
aq) 48 сполук формули (I.aq):

5



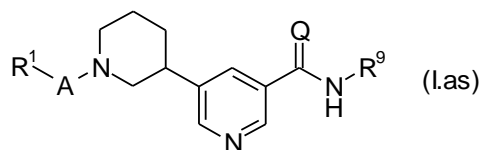
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ar) 48 сполук формули (I.ar):

10



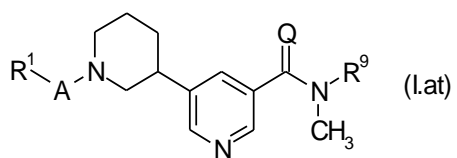
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
as) 48 сполук формули (I.as):

15



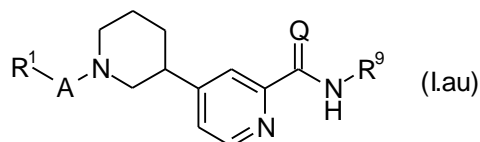
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
at) 48 сполук формули (I.at):

20



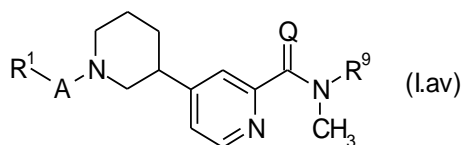
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
au) 48 сполук формули (I.au):

25



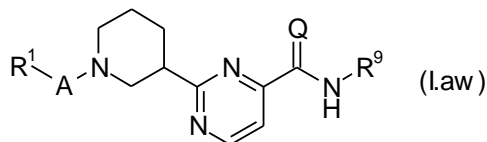
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
av) 48 сполук формули (I.av):

30



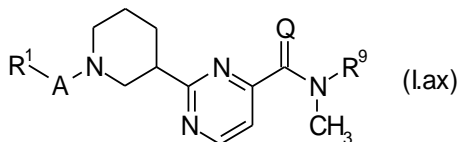
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
aw) 48 сполук формули (I.av):

5



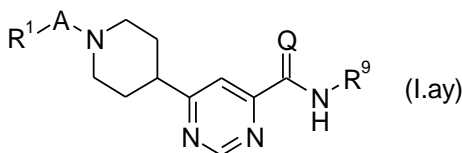
де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ax) 48 сполук формули (I.ax):

10



де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1;
ay) 48 сполук формули (I.ay):

15



де A, Q, R¹ та R⁹ визначені в таблиці 1.

У всьому даному описі температури наведені в градусах Цельсія, а "m.p." означає температуру плавлення. LC/MS означає рідинну хроматографію-мас-спектрометрію, а опис обладнання та способу є наступним: (ACQUITY UPLC від Waters, Phenomenex Gemini C18, розмір частинок 3 мкм, 110 ангстремів, колонка 30×3 мм, 1,7 мл/хв., 60 °C, H₂O+0,05 % HCOOH (95 %) / CH₃CN/MeOH 4:1+0,04 % HCOOH (5 %) - 2 хв. - CH₃CN/MeOH 4:1+0,04 % HCOOH (5 %) - 0,8 хв., мас-спектрометр ACQUITY SQD від Waters, спосіб іонізації: електророзпилення (ESI), полярність: позитивні іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 20,00, напруга екстрактора (В) 3,00, вихідна температура (°C) 150, температура десольватації (°C) 400, газовий потік у конусі (л/година) 60, газовий потік десольватації (л/година) 700)).

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS для сполук таблиці 1

Сполука №	Температура плавлення (°C)	LC/MS
I.v.001		Rt=1,10 хв.; MS: m/z=544 (M+1)
I.z.001		Rt=1,88 хв.; MS: m/z=544 (M+1)
I.ah.001		Rt=1,25 хв.; MS: m/z=545 (M+1)

30

Біологічні приклади

Обробка для попередження зараження листових дисків томату *Phytophthora infestans* (фітофторозом томату)

Листові диски томату поміщали на водний агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) і обприскували складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Листові диски

інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 16 °C та 75 % відносної вологості у світловому режимі 24 годин темряви з наступними 12 годинами світла/12 годинами темряви в камері штучного клімату, та оцінювали активність сполуки як відсоткове значення боротьби із захворюванням порівняно з

необробленими зразками, коли ушкодження від захворювання на відповідному рівні виявляли на необроблених перевірочних листових дисках (5-7 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними листовими дисками, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток

забурювання.

Обробка для попередження зараження картоплі *Phytophthora infestans* (фітофторозом картоплі)

2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Тестові рослини інокулювали шляхом обприскування їх суспензією спорангіїв через 2 дні після застосування. Інокульовані тестові рослини інкубували за 18 °C за світлового дня тривалістю 14 годин та 100 % відносної вологості у вегетаційній камері, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 5-7 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

Обробка для довгострокового попередження зараження картоплі *Phytophthora infestans* (фітофторозом картоплі)

2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Тестові рослини інокулювали шляхом обприскування їх суспензією спорангіїв через 6 днів після застосування. Інокульовані тестові рослини інкубували за 18 °C за світлового дня тривалістю 14 годин та 100 % відносної вологості у вегетаційній камері, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 9-11 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

Обробка для лікування картоплі від *Phytophthora infestans* (фітофторозу картоплі)

2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje інокулювали шляхом обприскування їх суспензією спорангіїв за один день до застосування. Інокульовані рослини обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Інокульовані тестові рослини інкубували за 18 °C за світлового дня тривалістю 14 годин та 100 % відносної вологості у вегетаційній камері, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 3-4 дні після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

Обробка для попередження зараження листових дисків винограду *Plasmopara viticola* (несправжньою борошнистою росою винограду)

Листові диски культурного винограду поміщали на водний агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) та обприскували складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 19 °C та 80 % відносної вологості у світловому режимі 12 годин світла/12 годин темряви в камері штучного клімату, та оцінювали активність сполуки як відсоткове значення боротьби із захворюванням порівняно з необробленими зразками, коли ушкодження від захворювання на відповідному рівні виявляли на необроблених перевірочних листових дисках (6-8 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими

контрольними листовими дисками, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

Обробка для попередження зараження винограду *Plasmopara viticola* (несправжньою борошнистою росою винограду)

5 5-тижневі сходи винограду сорту Gutedel обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Тестові рослини інокулювали шляхом обприскування нижньої поверхні їх листя суспензією спорангіїв за один день до застосування. Інокульовані тестові рослини інкубували за 22 °C та 100 % відносної вологості в теплиці, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 6-8 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

Обробка для довгострокового попередження зараження винограду *Plasmopara viticola* (несправжньою борошнистою росою винограду)

5-тижневі сходи винограду сорту Gutedel обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Тестові рослини інокулювали шляхом обприскування нижньої поверхні їх листя суспензією спорангіїв за 6 днів до застосування. Інокульовані тестові рослини інкубували за 22 °C та 100 % відносної вологості в теплиці, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 11-13 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

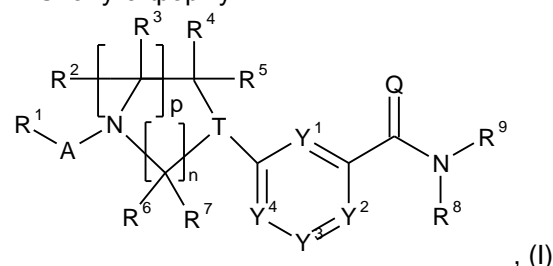
Обробка для лікування винограду від *Plasmopara viticola* (несправжньої борошнистої роси винограду)

5-тижневі сходи винограду сорту Gutedel інокулювали шляхом обприскування нижньої поверхні їх листя суспензією спорангіїв за один день до застосування. Інокульовані рослини винограду обприскували у зрошувальній камері складеною тестовою сполукою, розведеною у воді. Інокульовані тестові рослини інкубували за 22 °C та 100 % відносної вологості в теплиці, та оцінювали відсоткове значення площі листового диска, покритої захворюванням, коли захворювання на відповідному рівні виявляли у необроблених перевірочних рослин (через 4-6 днів після застосування).

Застосовуючи сполуки I.v.001, I.z.001 та I.ah.001 у кількості 200 частин на мільйон, досягали щонайменше 80 % боротьби із захворюванням у даному тесті порівняно з необробленими контрольними рослинами, які за тих самих умов демонстрували широкий розвиток захворювання.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I:



де

A являє собою x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)-, x-N(R¹⁴)-C(=O)-, x-N(R¹⁵)-C(=S)- або x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, x-N=C(R³⁰)-, при цьому в кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R¹;

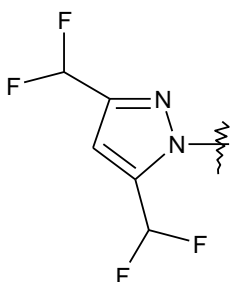
T являє собою CR¹⁸ або N;

Y¹, Y², Y³ та Y⁴ незалежно являють собою CR¹⁹ або N;

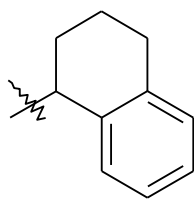
Q являє собою O або S;

n дорівнює 1 або 2;

р дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо п дорівнює 2, то р дорівнює 1;
 R^1 являє собою



- 5 кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}$ та R^{30} незалежно являє собою водень, галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл; кожний з R^8, R^{14} та R^{15} незалежно являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл; та R^9 являє собою феніл, бензил або групу (а):



, (a)

- 10 де кожний з фенілу, бензилу та групи (а) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, галогену, ціано, гідрокси та аміно; або її сіль, або N-оксид.

2. Сполука за п. 1, де

А являє собою $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, при цьому в кожному випадку х вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

- 15 Т являє собою CR^{18} або N;

Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} ;

Q являє собою O або S;

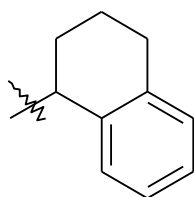
п дорівнює 1 або 2;

- 20 р дорівнює 1;

кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл;

R^8 являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл; та

R^9 являє собою феніл, бензил або групу (а):



, (a)

- 25

де кожний з фенілу, бензилу та групи (а) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, галогену, ціано, гідрокси та аміно.

3. Сполука за п. 1, де

А являє собою $x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CR^{16}R^{17}-SO_2-$, при цьому в кожному випадку х вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

- 30

Т являє собою CR^{18} ;

Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CR^{19} або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 являють собою CR^{19} , та за умови, що в кільці, яке містить Y^1, Y^2, Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки;

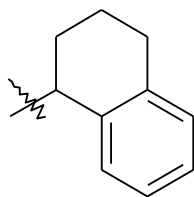
- 35 Q являє собою O або S;

п дорівнює 1 або 2;

р дорівнює 1;

кожний з $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно являє собою водень, фтор або метил;

R^8 являє собою водень або метил; та
 R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



, (a)

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно
 5 вибраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алогеналкілу, гідрокси та галогену.

4. Сполука за п. 1, де

A являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CH_2-SO_2-$, при цьому в кожному випадку x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

T являє собою CH;

10 Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CH або N за умови, що щонайменше 2 з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH, та за умови, що в кільці, яке містить Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 , відсутні N-N-зв'язки;

Q являє собою O;

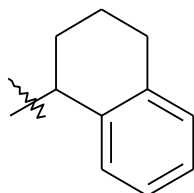
n дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 1;

15 кожний з R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 являє собою водень;

R^8 являє собою водень або метил; та

R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



, (a)

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно
 20 вибраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алогеналкілу, гідрокси та галогену.

5. Сполука за п. 1, де

A являє собою $x-CH_2-C(=O)-$, де x вказує на зв'язок, з'єднаний з R^1 ;

T являє собою CH;

Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 незалежно являють собою CH;

25 Q являє собою O;

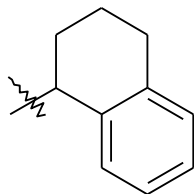
n дорівнює 2;

p дорівнює 1;

кожний з R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 являє собою водень;

R^8 являє собою водень або метил; та

30 R^9 являє собою феніл, бензил або групу (a):



, (a)

де кожний з фенілу, бензилу та групи (a) необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно
 вибраними з метилу, галогенметилу та галогену.

35 6. Сполука за будь-яким з пп. 1-5, де щонайменше три з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являють собою CH, а інший з Y^1 , Y^2 , Y^3 та Y^4 являє собою CH або N.

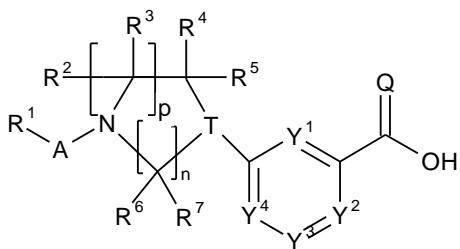
7. Сполука за будь-яким з пп. 1-6, де Y^2 являє собою N.

8. Сполука за будь-яким з пп. 1-7, де p дорівнює 1, та n дорівнює 2.

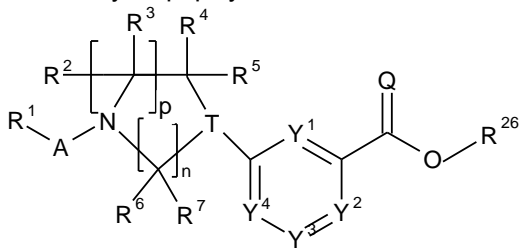
9. Сполука за будь-яким з пп. 1-8, де R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 являють собою H.

10. Сполука за будь-яким з пп. 1-9, де Q являє собою O.

40 11. Сполука формули II:



де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для формули I за будь-яким з пп. 1-10; або сполука формули IV:

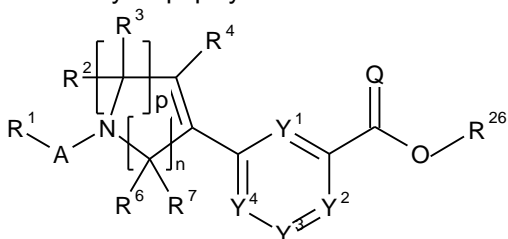


5 , (IV)

де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для формули I за будь-яким з пп. 1-10; та

R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил;

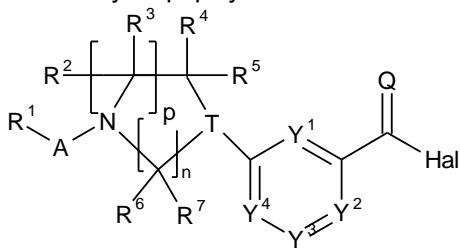
10 або сполука формули V:



де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для формули I за будь-яким з пп. 1-10; та

R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або необов'язково заміщений арил;

15 або сполука формули XI:



де $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ та R^7 мають визначення, описані для формули I за будь-яким з пп. 1-10; та Hal означає галоген.

12. Сполука за п. 11, де R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або феніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, гідроксилу, аміно, ціано та галогену.

13. Фунгіцидна композиція, яка містить щонайменше одну сполуку за будь-яким з пп. 1-10 та носій, прийнятний з погляду сільського господарства, яка необов'язково містить допоміжний засіб та яка необов'язково містить щонайменше одну додаткову фунгіцидно активну сполуку.

14. Спосіб боротьби із зараженням або попередження зараження рослин, матеріалу для їхнього розмноження, зібраних культур або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини, який включає застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-10 стосовно рослини, частин рослини, або місця її зростання, або матеріалу для її розмноження, або будь-якої частини неживих матеріалів.

15. Спосіб за п. 14, який **відрізняється** тим, що фітопатогенні мікроорганізми являють собою грибкові організми.

Комп'ютерна верстка Т. Вахричева

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

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