



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **108101**

(13) **C2**

(51) МПК

**A01N 43/54** (2006.01)

**A61K 31/505** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

<b>(21)</b> Номер заявки:	<b>а 2012 13412</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и):	<b>Бібел Тімоті (US), Лорсбах Бет (US), Мартін Тімоті (US), Оуен У. Джон (US), Салленбергер Майкл (US), Вебстер Джеффри (US), Яо Ченлінь (US)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки:	<b>20.04.2011</b>	<b>(73)</b> Власник(и):	<b>ДАУ АГРОСАЙЄНСІЗ ЕЛЕЛСІ, 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268, United States of America (US)</b>
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на винахід:	<b>25.03.2015</b>	<b>(74)</b> Представник:	<b>Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115</b>
<b>(31)</b> Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>61/327,855</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	<b>WO 2009094442 A2, 30.07.2009 EP 1952689 A1, 06.08.2008</b>
<b>(32)</b> Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>26.04.2010</b>		
<b>(33)</b> Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	<b>US</b>		
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку:	<b>25.02.2013, Бюл.№ 4</b>		
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту:	<b>25.03.2015, Бюл.№ 6</b>		
<b>(86)</b> Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	<b>PCT/US2011/033203, 20.04.2011</b>		

**(54) ПОХІДНІ N3-ЗАМІЩЕНИХ N1-СУЛЬФОНІЛ-5-ФТОРПІРИМІДИНОНІВ**

**(57) Реферат:**

Даний винахід стосується N3-заміщених N1-сульфоніл-5-фторпіримідинонів і їх похідних і застосування цих сполук як фунгіцидів.

UA 108101 C2



Перехресне посилання на споріднені заявки

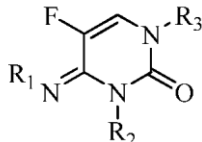
Дана заявка заявляє пріоритет по попередній патентній заявці США серійний № 61/327855, зареєстрованій 26 квітня 2010 р., яка повністю включена в даний опис як посилання.

Рівень техніки й Суть винаходу

5 Фунгіциди - це сполуки, природного або синтетичного походження, які захищають і/або лікують рослини від пошкоджень, викликаних сільськогосподарсько важливими грибами. Відповідно, дослідження спрямоване на створення фунгіцидів, які можуть давати кращий ефект, бути легшими у використанні й дешевшими.

10 Даний винахід стосується N3-заміщених N1-сульфоніл-5-фторпіримідинонових сполук та їх застосування як фунгіцидів. Сполуки даного винаходу можуть надавати захисну дію проти аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтеромицетів і ооміцетів.

Один аспект даного винаходу може включати сполуки формули I:



I

де R<sub>1</sub> означає: H;

15 R<sub>2</sub> означає:

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, необов'язково заміщений R<sub>4</sub>;

бензил, необов'язково заміщений 1-3 R<sub>5</sub>;

R<sub>3</sub> означає S(O)<sub>2</sub>R<sub>6</sub>;

20 R<sub>4</sub> незалежно означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкілтіо, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкілкарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкіламінокарбоніл, гідроксил або C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> триалкілсиліл;

25 R<sub>5</sub> незалежно означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкілтіо, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> діалкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

R<sub>6</sub> означає C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкіл, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> діалкіламіно, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sub>5</sub>, або 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sub>5</sub>.

30 Наступний аспект даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для приглушення або запобігання грибковому впливу, що містить сполуки, описані вище, і фітологічно прийнятний носій.

35 Ще один аспект даного винаходу може включати спосіб приглушення або запобігання грибковому впливу на рослину, що включає стадії застосування фунгіцидно ефективною кількості однієї або більше сполук, описаних вище, до принаймні одного із грибків, рослини, ділянки, суміжної з рослиною, і насіння, придатного до проростання рослини.

Термін "алкіл" стосується розгалуженого, нерозгалуженого або циклічного вуглецевого ланцюга, включаючи метил, етил, пропіл, бутіл, ізопропіл, ізобутіл, третинний бутіл, пентил, гексил, циклопропіл, циклобутіл, циклопентил, циклогексил тощо.

40 Термін "R", як використовується у всьому описі, стосується групи, що складається з C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> алкілу, якщо не вказане інше.

Термін "алкокси" стосується замісника -OR.

Термін "алкоксикарбоніл" стосується замісника -C(O)-OR.

Термін "алкілкарбоніл" стосується замісника -C(O)-R.

45 Термін "алкілтіо" стосується замісника -S-R.

Термін "галогеналкілтіо" стосується алкілтіогрупи, яка заміщена Cl, F, I або Br, або будь-якою їх комбінацією.

Термін "триалкілсиліл" стосується -SiR<sub>3</sub>.

Термін "ціано" стосується замісника -C=N.

50 Термін "гідроксил" стосується замісника -OH.

Термін "аміно" стосується замісника -NH<sub>2</sub>.

Термін "алкіламіно" стосується замісника -N(H)-R.

Термін "діалкіламіно" стосується замісника -NR<sub>2</sub>.

Термін "галогеналкокси" стосується замісника -OR-X, де X означає Cl, F, Br або I, або будь-яку їх комбінацію.

Термін "галогеналкіл" стосується алкілу, заміщеного Cl, F, I або Br, або будь-якою їх комбінацією.

5 Термін "галоген" стосується одного або декількох атомів галогену Cl, F, Br і I.

Термін "нітро" стосується замісника -NO<sub>2</sub>.

У всьому винаході посилання на сполуки Формули I включає також оптичні ізомери й солі сполуки Формули I, і їх гідрати. Особливо, коли Формула I включає розгалужену алкільну групу, припускається, що такі сполуки включають оптичні ізомери й їх рацемати. Приклади солей включають: гідрохлорид, гідробромід, гідройодид, тощо.

10 Фахівцям також зрозуміло, що припустиме додаткове заміщення, якщо не вказане інше, яке відповідає правилам хімічного зв'язку й енергії напруги, й якщо продукт виявляє фунгіцидну активність.

Інший аспект даного винаходу представляє використання сполуки Формули I для захисту рослини проти впливу фітопатогенного організму або лікування рослини, зараженої фітопатогенним організмом, що включає внесення сполуки Формули I або композиції, що містить сполуку, у ґрунт, на рослину, на частину рослини, листя, коріння і/або насіння.

Крім того, ще один аспект даного винаходу представляє композицію, корисну для захисту рослини проти впливу фітопатогенного організму і/або лікування рослини, зараженої фітопатогенним організмом, що включає сполуку Формули I і фітологічно прийнятний носій.

Докладний опис даного винаходу

Сполуки даного винаходу можуть застосовуватися за будь-якою з відомих технологій, або як сполуки або як суміші, що містять сполуки. Наприклад, сполуки можуть застосовуватися для коріння, насіння або листя рослин для протидії різним грибкам без порушення комерційної цінності рослини. Матеріали можуть застосовуватися в будь-якій зазвичай використовуваній формі, наприклад, у вигляді розчинів, напиль (дустів), змочуваних порошків, текучих концентратів або емульсійних концентратів.

Переважно, сполуки даного винаходу застосовуються в формі композиції, що містить одну або декілька сполук Формули I із фітологічно прийнятним носієм. Концентрована композиція для застосування може бути диспергована у воді або в інших рідинах, або композиція може бути у вигляді тонкого порошку або гранул, які потім використовуються без додаткової обробки. Композиція може бути приготована відповідно до процедури, звичайної в практиці агрохімії.

Даний винахід розглядає всі засоби, на основі яких одна або більше сполук може бути приготована для доставки й використання як фунгіциду. Як правило, препарати застосовують як водні суспензії або емульсії. Такі суспензії або емульсії можуть бути отримані з водорозчинних, водно-суспендованих або емульгованих форм, які є твердими речовинами, зазвичай відомими як змочувані порошки; або рідинами, зазвичай відомими як емульговані концентрати, водні суспензії або суспензійні концентрати. Легко зрозуміти, що до цих сполук можна додавати будь-який матеріал для надання бажаного застосування без істотного порушення активності цих сполук як протигрибкових агентів.

Змочувані порошки, які можуть бути сформовані так, щоб утворити дисперговані у воді гранули, містять внутрішню суміш однієї або більше сполук Формули I, інертний носій і поверхнево-активні речовини. Концентрація сполуки у змочуваному порошку може бути від приблизно 1 відсотка до приблизно 90 вагових відсотків, від загальної ваги змочуваного порошку, більш переважно, від приблизно 25 вагових відсотків до приблизно 75 вагових відсотків. При приготуванні рецептури змочуваних порошків сполуки можуть бути об'єднані з будь-яким тонко подрібненим твердим матеріалом, таким як пірофіліт, тальк, крейда, гіпс, Фуллерова земля, бентоніт, атапульгіт, крохмаль, казеїн, глютен, монтморилонітові глини, діатомові землі, очищені силікати або тощо. При таких маніпуляціях тонко подрібнений носій і поверхнево-активні речовини зазвичай збовтують із сполукою(ами) і потім перемелюють.

Емульсійні концентрати сполук Формули I можуть містити відповідну концентрацію, таку як від приблизно 1 вагового відсотка до приблизно 50 вагових відсотків сполуки у відповідній рідині, від загальної ваги концентрату. Сполуки можуть бути розчинені в інертному носії, який є розчинником, що змішується з водою, або сумішшю, вода-органічні розчинники, які не змішуються, й емульгатори. Концентрати можуть бути розбавлені водою й олією з утворенням спреї-сумішей у формі емульсій олія-у-воді. Використовувані органічні розчинники включають ароматичні розчинники, особливо висококиплячі нафталенові й олефінові фракції нафти, такі як важкий ароматичний лігроїн. Інші органічні розчинники також можуть бути використані, наприклад, терпенові розчинники, включаючи похідні смоли, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон, і складні спирти, такі як 2-етоксіетанол.

Емульсифікатори, які можуть бути успішно застосовані при цьому, можуть бути легко визначені фахівцями в даній сфері, і включають різні неіонні, аніонні, катіонні й амфотерні емульсифікатори, або суміш двох або більше емульсифікаторів. Приклади неіонних емульсифікаторів, використовуваних при приготуванні емульгованих концентратів, включають

5 ефіри поліалкіленгліколю й продукти конденсації алкіл- і арилфенолів, аліфатичних спиртів, аліфатичних амінів або жирних кислот із оксидом етилену, оксидом пропілену, такі як етоксировані алкілфеноли й карбоксильні ефіри, солюбілізовані з поліолом або поліоксіалкіленом. Катіонні емульгатори включають четвертинні амонієві сполуки й солі жирних амінів. Аніонні емульгатори включають розчинні в олії солі (наприклад, кальцієві)

10 алкіларилсульфонових кислот, розчинні в олії солі сульфатованих полігліколевих ефірів й прийнятні солі фосфатованого полігліколевого ефіру.

Характерні органічні рідини, які можуть бути застосовані при отриманні емульгованих концентратів сполук даного винаходу, представлені ароматичними рідинами, такими як ксилол, пропіл бензинові фракції; або змішаними нафталіновими фракціями, мінеральними маслами, або заміщеними ароматичними органічними рідинами, такими як діоктилфталат; гасом; діалкіламидами різних жирних кислот, особливо диметиламидами жирних гліколей і похідними гліколей, такими як н-бутиловий ефір, етиловий ефір або метиловий ефір діетиленгліколю, метиловий ефір триетиленгліколю, нафтовими фракціями або вуглеводнями, такими як мінеральне масло, ароматичними розчинниками, парафіновими оліями тощо; рослинними оліями, такими як олія соєвих бобів, олія ріпакового насіння, оливкова олія, рицинова олія, олія насіння соняшника, кокосова олія, кукурудзяна олія, олія насіння бавовни, олія льняного насіння, пальмова олія, арахісова олія, сафлорова олія, кунжутна олія, тунгова олія, тощо, ефірами перелічених вище рослинних олій; тощо. Суміші двох або більше органічних рідин також можуть використовуватися в приготуванні емульсифікованого концентрату. Органічні рідини включають ксиленову й пропіл бензинову фракції, при цьому ксиленова найбільш переважна в деяких випадках. Поверхнево-активні диспергуючі агенти, як правило, використовуються в рідкій композиції в кількості від 0,1 до 20 вагових відсотків, від загальної ваги диспергуючого агента з одним і більше сполученнями. Суміш може також містити інші сумісні добавки, наприклад, регулятори росту рослини й інші біологічно активні сполуки, що

20 використовуються в сільському господарстві.

Водні суспензії містять одну або більше водо-нерозчинних сполук Формули I, диспергованих у водному середовищі при концентрації в інтервалі від приблизно 1 до приблизно 50 вагових відсотків, від загальної ваги водної суспензії. Суспензії готують тонким подрібненням однієї або більше сполук і інтенсивним перемішуванням розмолотого матеріалу в середовищі, що містить

35 воду й поверхнево-активні речовини, вибрані з тих типів, які перелічені вище. Інші компоненти, такі як неорганічні солі й синтетичні або природні смоли також можуть бути додані для збільшення густини й в'язкості водного середовища.

Сполуки Формули I можуть також застосовуватися в гранульованій формі, що особливо зручно при використанні для ґрунту. Гранульовані форми зазвичай містять від приблизно 0,5 до

40 приблизно 10 вагових відсотків із розрахунку на загальну вагу гранульованої форми сполуки (сполук), диспергованих у інертному носії, який складається повністю або в більшій частині з грубо стовченого інертного матеріалу, такого як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або аналогічна недорога субстанція. Такі суміші зазвичай готують розчиненням сполук у відповідному розчиннику й додаванням його до гранульованого носія, якому додають відповідний розмір частинок у інтервалі від приблизно 0,5 до приблизно 3 мм. Відповідним розчинником є такий розчинник, в якому сполука значною мірою або повністю розчинна. Такі суміші можуть також бути отримані приготуванням муки або пасти на основі носія, сполуки й розчинника з подальшим дробленням і висушуванням для отримання бажаної гранулярної частинки.

Пилоподібні форми (дусти), що містять сполуки Формули I, можуть бути отримані ретельним змішуванням однієї або більше сполук у порошкоподібній формі з відповідним тонкоподрібненим (пилоподібним) агрономічним носієм, таким як, наприклад, каолінова глина, вулканічна земляна порода тощо. Пилоподібні форми можуть містити від приблизно 1 до

50 приблизно 10 вагових відсотків сполук, від загальної ваги пилоподібної форми.

Композиції можуть додатково включати допоміжні поверхнево-активні речовини для збільшення осадження (розподілу), змочування й проникнення сполук у цільову сільськогосподарську культуру й організм. Ці допоміжні поверхнево-активні речовини можуть необов'язково застосовуватися як компоненти композицій або в їх суміші. Кількість допоміжної поверхнево-активної речовини, як правило, варіюється від 0,01 до 1,0 об'ємних відсотка, основуючись на об'ємі розпиленої води, переважно, від 0,05 до 0,5 об'ємних відсотка. Відповідні

60

допоміжні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються цим, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або природні спирти, солі ефірів або сульфобурштинових кислот, етоксировані органосилікони, етоксировані жирні аміни, суміші ПАВ із мінеральними маслами або рослинними оліями, концентрати олій сільськогосподарських культур (мінеральне масло (85 %) + емульгатори (15 %)); нонілфенолетоксилат; бензилкооалкїлдиметил четвертинна амонієва сіль; суміш вуглеводнів нафти, алкілових ефірів, органічної кислоти й аніонного ПАВ; C<sub>9</sub>-C<sub>11</sub> алкілполіглікозид; етоксилат фосфорированого спирту; етоксилат природного первинного спирту (C<sub>12</sub>-C<sub>16</sub>); блок співполімер ди-вторбутилфенол ЕО-РО; полісилоксан із метиловим наверхом; етоксилат нонілфенолу + сечовина амоній нітрат; емульгована метилована олія насіння; етоксилат тридецилового спирту (синтетичного) (8ЕО); етоксилат жирних амінів(15 ЕО); ПЕГ (400) діолеат-99. Форми можуть також включати емульсії типу олія-в-воді, такі як запропоновані у Патентній Заявці США № 11/495228, яка повністю приведена в даному описі у вигляді посилання.

Склади можуть необов'язково включати комбінації, які містять інші пестицидні сполуки. Такими додатковими пестицидними сполуками можуть бути фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематодциди, акарициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні зі сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для застосування, і які не мають антагоністичну дію щодо активності пропонованих у даному описі сполук. Відповідно, у таких аспектах інша пестицидна сполука застосовується як додатковий токсикант для того ж або іншого пестицидного використання. Сполуки Формули І і інша пестицидна сполука в комбінації можуть бути присутніми у співвідношенні від 1:100 до 100:1.

Сполуки за даним винаходом можна також комбінувати з іншими фунгіцидами з утворенням фунгіцидної суміші й їх синергетичних сумішей. Фунгіцидні сполуки даного винаходу часто використовують в поєднанні з одним або більше з інших фунгіцидів для приглушення більш широкого спектру небажаних захворювань. При використанні в поєднанні з іншим фунгіцидом(ами) заявлені сполуки можуть утворювати форми з іншим фунгіцидом(ами), змішаними в резервуарі з іншим фунгіцидом(ами) або можуть застосовуватися послідовно з іншим фунгіцидом(ами). Такі інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатометилтіо)бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксихінолінсульфат, аметоктрадин, амізулбром, антимицин, *Ampelomyces quisqualis*, азаконазол, азоксистробін, *Bacillus subtilis*, беналаксил, беноміл, бентіавалікارب-ізопропіл, сіль бензиламінобензолсульфонат (БАБС), бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, боракс, Бордоську суміш, боскалід, бромуконазол, бупіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, хлоронеб, хлороталоніл, хлозолінат, *Coniothyrium minitans*, гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, сульфат міді (триосновний), окисел міді, ціазофамід, суфлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакارب, ді-етиленбіс(дитіокарбамат) діамоній, дихлорфлуанід, дихлорофен, дихлоцимет, дихломезин, дихлоран, діетофенкарб, дифеноконазол, іон дифензоквату, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон, додеморф, додеморф ацетат, додин, додину вільна основа, едифенфос енестробін, епоксиконазол, етабоксам, етоксикін, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпиклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентин, фентин ацетат, фентин гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, флуороїмід, флуоксастробін, флухінконазол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутріафол, фолпет, формальдегід, фосетил, фосетил-алюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатин ацетат, GY-81, гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазаліл, імазаліл сульфат, імібенконазол, іміноктадін, іміноктадин триацетат, іміноктадин тріс(альбесилат), іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, казугаміцин, казугаміцин гідрохлорид гідрат, крезоксим-метил, манкопер, манкозеб, мандіпропамід, манеб, мепаніпірим, мепроніл, хлорид ртуті, оксид ртуті, хлористу ртуть, металаксил, мефеноксам, металаксил-М, метам, амоній метам, калій метам, натрій метам, метконазол, метасульфокارب, метилйодид, метилізотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіоміцин, міклобутаніл, набам, нітротал-ізопропіл, нуаримол, октилінон, офуреїс, олеїнову кислоту (жирні кислоти), орисастробін, оксадіксил, оксин-мідь, окспоконазол фумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніл лаурат, пентіопірад, фенілмеркурацетат, фосфонову кислоту, фталід, пікоксистробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, калій гідроксихінолін сульфат, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, прохіназид, протіконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб,

пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, хінокламін, хіноксифен, хінтозен, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, седаксан, силтіофам, симеконазол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірка, SYP-Z071, SYP-Z048, олії рідких смол, тебуконазол, тебуффлохін, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, метилтіофанат, тирам, тіадиніл, метил-толклофос, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін, зинеб, зирам, зоксамід, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma* spp., (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл, -2-(метоксиметил)сукцинімід, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетон гідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазоліну-1-іл) етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіін 1,1,4,4-тетраоксид, 2-метоксіетилмеркурацетат, 2-метоксіетилмеркурхлорид, 2-метоксіетилмеркурсилікат, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл) фенілтіоціанат)ампропілфос, анілазин, азитирам, полісульфід барію, Bayer 32394, беноданіл, бенхінокс, бенталурон, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бінапакрил, біс(метилмеркур)сульфат, біс(трибутилолово)оксид, бутіобат, кадмій кальцій мідь цинк хромат сульфат, карбаморф, СЕСА, хлорбентіазон, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорхінокс, клімбазол, біс(3-фенілсаліцилат) міді, мідь цинк хромат, куфранеб, гідразиніум сульфат міді, купробам, циклафурамід, ципендазол, купроферам, декафентин, дихлон, дихлозолін, диклобутразол, диметиримол диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритіон, диталімфос, додицин, дразоксолон, ЕВР, ЕSBP, етаконазол, етем, етирим, фенаміносальф, фенапаніл, фенітропан, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофульвін, галакринат, Hercules 3944, гексилтіофос, ICIA0858, ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксалон, метфуроксам, метилмеркурдиціандіамід, метсульфовакс, мілнеб, ангідрид борошнохлорної кислоти, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилмеркур-4-толуолсульфонанілід, біс(диметилдитіокарбамат)нікелю, ОСН, фенілмеркурдиметилдитіокарбамат, фенілмеркурнітрат, фосдіфен, протіокарб, протіокарб гідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксиклор, піроксифур, хінацетол, хінацетол сульфат, хіназамід, хінконазол, рабензазол, саліциланілід, SSF-109, сультропен, текорам, тіадифлор, тиціофен, тіохлорфенфін, тіофанат, тіохінокс, тіоксимід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихламід, урбацид і зариламід і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки даного винаходу можуть бути об'єднані з іншими пестицидами, включаючи інсектициди, нематодциди, аскарициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні зі сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для застосування, і неантагоністичні стосовно активності пропонованих сполук, для того, щоб отримувати пестицидні суміші й їх синергетичні суміші. Фунгіцидні сполуки даного винаходу можуть застосовуватися разом з одним або більше іншими пестицидами для боротьби з більш широким колом небажаних шкідників. При використанні разом із іншими пестицидами, заявлені сполуки можуть бути сформульовані з іншим пестицидом(и), змішані в резервуарі з іншим пестицидом(и) або застосовуватися послідовно з іншим пестицидом(и). Типові пестициди включають, але не обмежуються цим: 1,2-дихлорпропан, абамектин, ацефат, ацетаміприд, ацетіон, ацетопрол, акринатрин, акрилонітрил, аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, алдрин, алетрин, алозамідин, аліксикарб, альфа-циперметрин, альфа-екдизон, альфа-ендосальфан, амідитіон, амінокарб, амітон, амітон оксалат, амітраз, анабазин, атідатіон, азадирахтин, азаметіфос, азинфос-етил, азинфос-метил, азотоат, гексафторсилікат барію, бартрин, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, біфентрин, біоалетрин, біоетанометрин, біоперметрин, бістрифлурон, боракс, борну кислоту, бромфенвінфос, бромциклен, бром-ДДТ, бромфос, бромфос-етил, буфенкарб, бупрофезин, бутаккарб, бутатіофос, бутоксикарбоксим, бутонат, бутоксикарбоксим, кадусафос, арсенат кальцію, полісульфід кальцію, камфехлор, карбанолат, карбарил, карбофуран, сірковуглець, чотирихлористий вуглець, карбофенотіон, карбосульфан, картап, картап гідрохлорид, хлорантраніліпрол, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлордимеформ гідрохлорид, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлортіофос, хромафенозид, цинерин I, цинерин II, цинерини, цисметрин, клоетокарб, клосантел, клотіанідин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, нафтенат міді, олеат міді, коумафос, коумітоат, кротамітон, кротоксифос, круфомат, кріоліт, ціанофенфос, ціанофос, ціантоат, ціантраніліпрол, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин, цифенотрин, циромазин, цитіоат, ДДТ, декарбофуран, дельтаметрин, демефіон, демефіон-О, демефіон-S, деметон, деметон-метил, деметон-О,

деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діатомову землю, діазинон, дикаптон, дихлофентіон, дихлорвос, дикрезил, дикротофос, дицикланіл, діелдрин, дифлубензурон, дилор, димефлутрин, димефокс, диметан, диметоат, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динекс, динекс-диклексин, динопроп,

5 диносам, динотефуран, діофенолан, діоксабензофос, діоксакарб, діоксатіон, дисульфотон, дитікрофос, d-лімонен, DNOC, DNOC-амоній, DNOC-калій, DNOC-натрій, дорамектин, екдистерон, емаектин, емаектин бензоат, EMPC, емпентрин, ендосульфат, ендотіон, ендрин, EPN, епофенонан, еприномектин, есдепалетрин, есфенвалерат, етафос, етіофенкарб, етіон, етіпрол, етоат-метил, етопрофос, етилформат, етил-ДДД, етилен дибромід, етилен дихлорид,

10 окисел етилену, етофенпрокс, етримфос, EXD, фамфур, фенаміфос, феназафлор, фенхлорфос, фенетакарб, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, феноксакрім, феноксикарб, фенпіритрин, фенпропатрин, фенсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флукофурон, флуциклоксурон, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксирон, флуфенпрокс, флувалінат, фонофос, форметанат, форметанат гідрохлорид,

15 формотіон, формпаранат, формпаранат гідрохлорид, фосметилан, фоспірат, фостіетан, фураціокарб, фуретрин, гамма-цигалотрин, гамма-HCH, галфенпрокс, галофенозид, HCH, HEOD, гептахлор, гептенофос, гетерофос, гексафлумурон, HHND, гідраметилнон, ціаністий водень, гідропрен, гіхінкарб, імідаклопрід, іміпротрин, індоксакарб, йодистий метил, IPSP, ізазофос, ізобензан, ізокарбофос, ізадрин, ізофенфос, ізофенфос-метил, ізопрокарб,

20 ізопротіолан, ізотіоат, ізоксатіон, івермектин, ясмолін I, ясмолін II, іодфенфос, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III, келеван, кінопрен, лямбда-цигалотрин, арсенат свинцю, лепімектин, лептофос, ліндан, ліримфос, луфенурон, літідатіон, малатіон, малонобен, мазидокс, мекарбам, мекарфон, меназон, мефосфолан, хлорид ртуті, месульфенфос, метафлумезон, метакрифос, метамідофос, метідатіон, метіокарб,

25 метокротофос, метоміл, метопрен, метоксихлор, метоксифенозид, бромистий метил, метилізотіоціанат, метилхлороформ, хлористий метилен, метофлутрин, метолкарб, метоксадіазон, мевінфос, мексакарбат, мілбебектин, мілбебецин оксим, міпафокс, мірекс, молосультап, монокротофос, мономегіро, моносультат, морфотіон, моксидектін, нафталофос, налед, нафталін, нікотин, ніфлуридин, нітенпірам, нітіазин, нітрилакарб, новалурон,

30 новіфлумурон, ометоат, оксамит, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, парадихлорбензол, паратіон, паратіон-метил, пенфлурон, пентахлорфенол, перметрин, фенкаптон, фенотрин, фентоат, форат, фосалон, фосфолан, фосмет, фосніхлор, фосфамідон, фосфін, фоксим, фоксим-метил, піриметафос, піримікарб, піриміфос-етил, піриміфос-метил, калій арсеніт, калій тіоціанат, п, п'-ДДТ, пралетрин, прокоцен I, прокоцен II, прокоцен III, прімідофос,

35 профенофос, профлуралін, промацил, промекарб, пропафос, пропетамфос, пропоксур, протідатіон, протіофос, протоат, протрифенбут, піраклофос, пірафлупрол, піразофос, піресметрин, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридабен, піридаліл, піридафентіон, пірифлухіназон, піримідифен, піримітат, пірипрол, пірипроксифен, квасія, квіналфос, квіналфос-метил, квінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, ріанія, сабаділа, шрадан, селамектин,

40 сілафлуофен, силікагель, натрію арсеніт, натрію фторид, натрію гексафторсилікат, натрію тіоціанат, софамід, спінеторам, спіносад, спіромесифен, спіротетрамат, сулькофурон, сулькофурон-натрій, сульфурамід, сульфотеп, сульфоксафлор, сульфурил фторид, сульпрофос, тау-флувалінат, тазимкарб, TDE, тебуфенозид, тебуфенпірад, тебупіримфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, TEPP, тералетрин, тербуфос, тетрахлоретан,

45 тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тікрофос, тіокарбоксим, тіоциклам, тіоциклам оксалат, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосультап, тіосультап-динатрій, тіосультап-моно-натрій, тюрінгінсин, толфенпірад, тралометрин, трансфлутрин, трансперметрин, триаратен, триазамат, триазафос, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлоронат, трифенофос, трифлумурон, триметакарб, трипрен,

50 вамідотіон, ваніліпрол, ХМС, ксилілкарб, зета-циперметрин, золапрофос і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки даного винаходу можуть бути об'єднані з гербіцидами, які сумісні зі сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для застосування, і неантагоністичні стосовно активності пропонованих сполук, для отримання пестицидних сумішей і їх синергетичних сумішей. Фунгіцидні сполуки даного винаходу можуть застосовуватися в

55 поєднанні з одним або більше гербіцидом для боротьби з більш широким колом небажаних шкідників. При використанні в поєднанні з гербіцидами заявлені сполуки можуть бути змішані з гербіцидом(и), змішані з гербіцидом(ами) в резервуарі, або застосовуватися послідовно з гербіцидом(ами). Типові гербіциди включають, але не обмежуються цим: 4-CPA; 4-CPB; 4-CPD; 2,4-D; 3,4-DA; 2,4-DB; 3,4-DB; 2,4-DEB; 2,4-DEP; 3,4-DP; 2,3,6-TBA; 2,4,5-T; 2,4,5-TB; ацетохлор,

60 ацифлуорфен, аклоніфен, акролеїн, алахлор, алідохлор, алоксидим, аліловий спирт, алорак,



аметридіон, аметрин, амібозин, амікарбазон, амідосульфурон, аміноциклопірахлор, амінопіралід, аміпрофос-метил, амітрол, сульфамат амонію, анілофос, анісурон, асулам, атратон, атразин, азафенідин, азимсульфурон, азіпротрин, барбан, ВСПС, бєфлубутамід, беназолін, бенкарбазон, бенфлуралін, бенфуресат, бенсульфурон, бенсулід, бєнтазон, 5 бензадокс, бензфєндизон, бензипрам, бензобіциклон, бензофєнап, бензофлуор, бензоїлпроп, бензтіазурон, біциклопірон, біфєнокс, біланафос, біспірибак, буру, бромацил, бромобоніл, бромобутид, бромофєноксим, бромоксиніл, бромпіразон, бутахлор, бутафєнацил, бутаміфос, бутєнахлор, бутідазол, бутіурон, бутралін, бутроксидим, бутурон, бутилат, кокадалову кислоту, кафєнстрол, хлорат кальцію, ціанамід кальцію, камбєндихлор, карбасулам, карбєтамід, 10 карбоксазол, хлорпрокарб, карфєтразон, CDEA, СЕРС, хломєтоксифєн, хлорамбєн, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлорєтурон, хлорфєнак, хлорфєнпроп, хлорфлуразол, хлорфлуєнол, хлоридазон, хлорімурон, хлорнітрофєн, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксиніл, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал, хлортіамід, цимідон-єтил, цинмєтилін, циносульфєн, цисанілід, клєтодим, кліодинат, 15 клодинафоп, клофоп, кломазон, кломєпроп, клопроп, клопроксидим, клопіралід, клорансулам, СМА, сульфат міді, СРМФ, СРРС, кредазин, крєзол, цумілурон, ціанатрин, ціаназин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, циклурон, цигалофоп, ципєрквот, ципразин, ципразол, ципромід, даймурон, далапон, дазомєт, дєлахлор, дєсмєдифам, дєсмєтрин, ді-алат, дикамба, дихлєбєніл, дихлоральсєчєвина, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, 20 диклосулам, дієтамквот, дієтатил, дифєнопєнтєн, дифєноксурон, дифєнзєквот, дифлуфєнікан, дифлуфєнзєпір, димєфурон, димєпієрат, димєтахлор, димєтаємєтрин, димєтєнамід, димєтєнамід-Р, димєксано, димідазон, динітрамін, динофєнат, динопроп, диносам, диносєб, динотєрб, дифєнамід, дипропєтрин, диквот, дисул, дитіопір, діурон, DMPA, DNOC, DSMA, EBER, єгліназин, єндотал, єпроназ, EPTC, єрбон, єспрокарб, єталфлуєралін, єтаєтєсульфурон, 25 єтидимурон, єтієлат, єтофумєзат, єтоксифєн, єтоксисульфурон, єтинофєн, єтніпромід, єтобєнзамід, EXD, фєнасулам, фєнопроп, фєноксапроп, фєноксапроп-Р, фєноксасульфєн, фєнтєракол, фєнтіапроп, фєнтразамід, фєнурон, сульфат заліза, флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флорасулам, флуазіфоп, флуазіфоп-Р, флуазєлат, флукарбазон, флуєтєтєсульфурон, флухлєралін, флуфєнаєт, флуфєнікан, флуфєнпір, флумєтєсулам, 30 флумєзін, флуміклєрак, флумієксазин, флуміпропін, флуомєтурон, фтородифєн, фторєглієфєн, фторємідин, фторєнітрофєн, флуєтіурон, флупєксам, флупропацил, флупропанат, флупірсульфурон, флуєридон, флуєрохлєридєн, флуєроксипір, флуртамєн, флутіаєт, фомєсафєн, форамсульфурон, фуєриєлєксифєн, глєфєсинат, глєфєсинат-Р, гліфєсат, галєсафєн, галєсульфурон, галєксидин, галєксифоп, галєксифоп-Р, гєксахлєраєтєн, 35 гєксахлурат, гєксазиєнєн, імазамєтабєнз, імазамєкс, імазепік, імазєпір, імазаквін, імазєтапір, імазасульфурон, інданєфєн, індазифлам, ієдбєніл, ієдмєтан, ієдсульфурон, ієксиніл, іпазін, іпфєнкарбазон, іпримідам, ізєкарбамід, ізєцил, ізємєтієзин, ізєнєруєн, ізєполінат, ізєпропалін, ізєпропурєн, ізєруєн, ізєксабєн, ізєксахлєртол, ізєксафлєтол, ізєксапієрифоп, карбутилат, кєтєспіраєдєкс, лактофєн, лєнаціл, лінурєн, МАА, МАМА, МСРА, МСРА-тієєтил, МСРВ, 40 мєкопроп, мєкопроп-Р, мєдінєтєрб, мєфєнаєт, мєфлєїдид, мєзєпразин, мєзєсульфурон, мєзєтриєн, мєтам, мєтаміфоп, мєтамітєн, мєтазахлор, мєтазасульфурон, мєтфлуєразон, мєтабєнзтіазурон, мєталпропалін, мєтазол, мєтієбєнкарб, мєтієзолін, мєтієруєн, мєтємєтєн, мєтєпропєтрин, мєтилбромід, мєтилізєтієціанат, мєтилдимєн, мєтєбєнзурєн, мєтєбромєруєн, мєтєлахлор, мєтєсулам, мєтоксурєн, мєтриєбузин, мєтєсульфурон, молінат, моналід, монієсуєн, 45 моєохлєроєтєву кислоту, моєолінурєн, моєнурєн, морфамквєт, MSMA, нєпроанілід, нєпропамід, нєпталам, нєбурєн, нієосульфурон, ніпіраклєфєн, нітралін, нітрофєн, нітрофлуєрфєн, нєрфлуєразон, нєруєн, ОСН, єрбєнкарб, єрто-дихлєрбєнзол, єртєсульфамієн, єризалін, єксадіаргіл, єксадіазєн, єксапієразон, єксаєсульфурон, єксаєиклємєфєн, єксифлуєрфєн, пєрафлурєн, пєраквєт, пєбулат, пєларгєнєву кислоту, пєндимєталін, пєноксєсулам, 50 пєнтахлєрфєнол, пєнтанєхлєр, пєнтєксазон, пєрфлєїдєн, пєтоксамід, фєнієсофам, фєнмєдифам, фєнмєдифам-єтил, фєнобєнзурєн, фєнілмєркуєраєтєтат, піклєрам, пієолінєфєн, пієноксєдєн, пієєрофєс, арсєніт кєлієу, азид кєлієу, ціанід кєлієу, прєтилахлєр, примієсульфурон, проціазин, продіамін, профлуєзол, профлуєрин, профєксидим, проєгліназин, промєтєн, промєтрин, пропахлєр, пропанєм, пропаквазєфоп, пропєзин, профам, пропієсохлєр, 55 пропєксикарбазон, пропієрсульфурон, пропієзамід, проєсульфалін, проєсульфєкарб, проєсульфурон, проксєн, приєнахлєр, піданєн, пієаклєніл, пієафлєфєн, пієрасульфєтєл, пієразєлієнат, пієразєсульфурон, пієразєксифєн, пієриєбєнзєксим, пієриєбутиєкарб, пієриєхлєр, пієридафєл, пієридаєт, пієрифталід, пієримієнєбак, пієримієсульфєн, пієритієнєбак, пієроксаєсульфєн, пієроксєсулам, квінклєрак, квінмєрак, квінєклєамін, квінєнамід, квієзєлофоп, квієзєлофоп-Р, рєдєтаніл, 60 римєсульфурон, сєфлудєнацил, S-мєтєлахлєр, сєбутиєлаєзин, сєкбумєтєн, сєтоксидим, сидурєн,

симазин, симетрин, SMA, арсеніт натрію, азид натрію, хлорат натрію, сулькотрион, сульфат, сульфентразон, сульфометурон, сульфосульфурон, сірчану кислоту, сульглікапін, свеп, ТСА, тебутам, тебутіурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлурон, тенілхлор, тіазафлурон, тіазопір, тідіазимін, тідіазурон, тієнкарбазон-метил, тіфенсульфурон, тіобенкарб, тіокарбазил, тіоклорим, топрамезон, тралкоксидим, три-алат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трикамба, триклопір, тридифан, триетазин, трифлорисульфурон, трифлуралін, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, тригідрокситриазин, триметурон, трмпропіндан, тритак, тритосульфурон, вернолат і ксилахлор.

Інший аспект даного винаходу являє собою спосіб приглушення або запобігання грибковому ураженню. Цей спосіб включає застосування до ґрунту, рослин, коріння, листя, насіння або плям плісняви або до місць, у яких потрібно запобігти інфікуванню (наприклад, стосовно зернових або виноградних рослин), ефективною в фунгіцидному відношенні кількості однієї або більше сполук Формули I. Сполуки застосовувані для обробки різних рослин на фунгіцидному рівні, оскільки виявляють низьку фітотоксичність. Сполуки можуть бути застосовувані для захисту і/або для знищення.

Знайдено, що сполуки мають значний фунгіцидний ефект, особливо для сільськогосподарського використання. Багато які сполуки особливо ефективні для використання для польових культур і садових рослин.

Фахівцям повинно бути зрозуміло, що ефективність сполук стосовно вищезазначених грибків визначає загальне застосування сполук як фунгіцидів.

Сполуки мають широке коло активності проти патогенних грибків. Приклади патогенів можуть включати, але не обмежуватися цим, плямистість листя пшениці (*Septoria tritici*), також відому як *Mycosphaerella graminicola*), яблучний струп (*Venturia inaequalis*), і *Cercospora* плямистість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і інших культур, і чорну сигатокку бананів (*Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість активного матеріалу, яка повинна бути застосована, залежить не тільки від специфічної активності застосованого матеріалу, а також від бажаної дії, виду грибків, які треба придушити, і стадії їх розвитку, також як від тієї частини рослини або іншого продукту, який буде контактувати з сполукою. Таким чином, всі сполуки і суміші, що їх містять, можуть не бути однаково ефективні в одних і таких самих концентраціях або проти таких самих типів грибків.

Сполуки є ефективними для рослин у інгібувальному захворюванні й фітологічно допустимій кількості. Термін "інгібувальне захворювання й фітологічно допустима кількість" означає кількість сполуки, яка повністю знищує грибки або інгібує захворювання рослини, яке бажано придушити, але яке не має виражену токсичну дію стосовно рослини. Ця кількість, як правило, складає від приблизно 0,1 до приблизно 1000 м. ч. (мільйонних часток), переважно, від 1 до 500 мільйонних часток. Точна необхідна концентрація сполуки варіюється залежно від грибового захворювання, яке підлягає придушенню, типу застосовуваної суміші, способу застосування, приватних видів рослини, кліматичних умов тощо. Відповідне використовуване співвідношення зазвичай складає інтервал від приблизно 0,10 до приблизно 4 фунтів/акра (приблизно 0,01-0,45 грам на квадратний метр, г/м<sup>2</sup>).

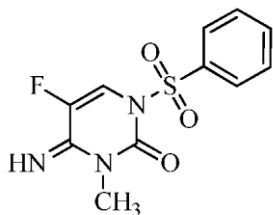
Будь-який інтервал або кількість, дана в даному описі, може бути розширена або змінена без втрати шуканих ефектів, як це повинно бути зрозуміло фахівцям.

Сполуки Формули I можуть бути отримані використанням добре відомих хімічних способів. Проміжні сполуки, спеціально не обумовлені в даному винаході, є або комерційно доступними, можуть бути отримані рутинними способами, описаними в хімічній літературі, або можуть бути легко отримані з комерційних вихідних матеріалів за стандартними методиками.

Наступні приклади надані для ілюстрації різних аспектів даного винаходу; їх не треба сприймати як обмеження об'єму.

Приклади:

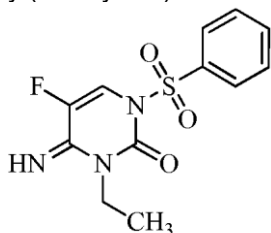
Приклад 1. Отримання 1-бензолсульфоніл-5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідро-1Н-піримідин-2-ону (Сполука 1)



4-Аміно-1-бензолсульфоніл-5-фтор-1Н-піримідин-2-он (200 мг, 0,74 ммоль) перемішували при кімнатній температурі в диметилформаміді (3 мл) разом із безводним карбонатом калію (210 мг, 1,5 ммоль). Додавали йодметан (210 мг, 1,5 ммоль), і суміш нагрівали 3 години при 60°C. Після охолодження до кімнатної температури суміш розділяли в суміші етилацетат (EtOAc) і вода. Органічну фазу сушили над сульфатом магнію, фільтрували і упарювали. Сирий продукт очищали хроматографією на силікагелі (градієнт 20-80 % EtOAc у петролейному ефірі), отримуючи 1-бензолсульфоніл-5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідро-1Н-піримідин-2-он (106 мг, 50 %) у вигляді твердої білої речовини: температура плавлення 144 °C, <sup>1</sup>H ЯМР (600 МГц, ДМСО-d<sub>6</sub>) δ 8,52 (с, 1H), 8,03-8,00 (м, 2H), 7,97 (д, J=5,9 Гц, 1H), 7,80-7,76 (м, 1H), 7,67-7,63 (м, 2H), 3,09 (с, 3H); мас-спектр із іонізацією електророзпиленням (МСІЕР): m/z 284 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуку 2-4 в таблиці 1 отримували за тією ж методикою, що й у прикладі 1.

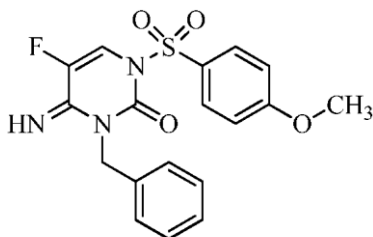
Приклад 2. Отримання 1-бензолсульфоніл-5-фтор-4-іміно-3-метил-3,4-дигідро-1Н-піримідин-2-ону (Сполука 1)



У 25 мл колбу, що закривається, вміщували 4-аміно-1-бензолсульфоніл-5-фтор-1Н-піримідин-2-он (1,0 г, 3,71 ммоль), безводний карбонат кальцію (K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, 2,05 г, 14,9 ммоль) і N,N-диметилформамід (ДМФ, 10 мл), із подальшим додаванням етилйодиду (EtI, 3,45 г, 22,3 ммоль). Реакційну посудину закривали, і реакційну суміш нагрівали при 60°C і перемішували протягом 1 години. Охолоджували реакційну суміш до кімнатної температури, розбавляли етилацетатом (EtOAc, 250 мл) і промивали водою (H<sub>2</sub>O, 3×100 мл). Органічну фазу сушили над сульфатом магнію (MgSO<sub>4</sub>), фільтрували, і розчинник упарювали при зниженому тиску. Після очищення флеш-хроматографією (SiO<sub>2</sub>, EtOAc/гексан градієнт) отримували бензолсульфоніл-5-фтор-4-іміно-3-етил-3,4-дигідро-1Н-піримідин-2-он у вигляді блідо-жовтої твердої речовини (200 мг, 18 %): температура плавлення 163-166°C; <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d<sub>6</sub>) δ 8,82 (м, 1H), 8,29 (д, J=6,8 Гц, 1H), 8,02 (дд, J=8,4, 1,1 Гц, 2H), 7,79 (ддд, J=6,9, 2,3, 1,1 Гц, 1H), 7,66 (дд, J=10,7, 4,9 Гц, 2H), 3,31 (кв, J=7,2 Гц, 2H), 1,09 (т, J=7,2 Гц, 3H); МСІЕР m/z 298 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуку 7-9 отримували так, як описано в Прикладі 2.

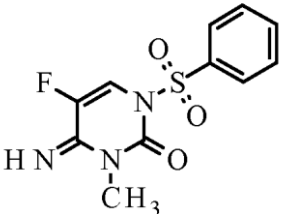
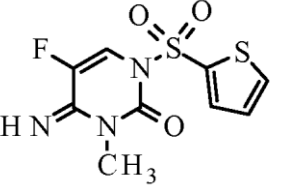
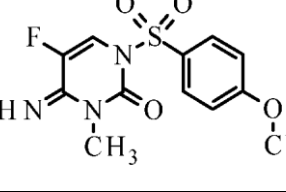
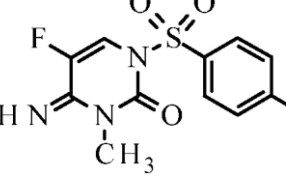
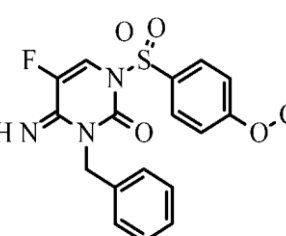
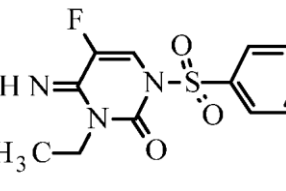
Приклад 3: Отримання 3-бензил-5-фтор-4-іміно-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-ону (сполука 5)



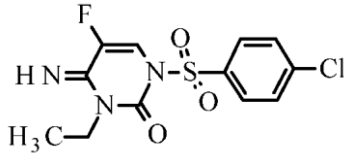
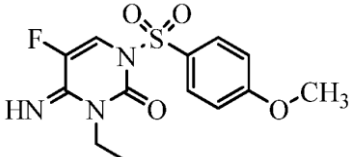
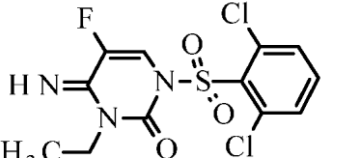
У 20 мл посудині для мікрохвильової обробки перемішували 5-фтор-4-іміно-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он (111 мг, 0,37 ммоль) при кімнатній температурі в диметилформаміді (3 мл) разом із безводним карбонатом калію (210 мг, 0,55 ммоль). Додавали бензилбромід (89 мкл, 0,75 ммоль). Реакційну посудину закривали й вміщували в мікрохвильовий реактор Biotage Initiator на 20 хв. при 130°C із зовнішнім ІЧ-контролем температури збоку від посудини. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, розбавляли етилацетатом (EtOAc, 250 мл) і промивали водою (H<sub>2</sub>O, 3×100 мл). Органічну фазу сушили над сульфатом магнію (MgSO<sub>4</sub>), фільтрували, і розчинник упарювали при зниженому тиску. Після очищення флеш-хроматографією (SiO<sub>2</sub>, EtOAc/гексан градієнт) отримували 3-бензил-5-фтор-4-іміно-1-(4-метоксифенілсульфоніл)-3,4-дигідропіримідин-2(1H)-он у вигляді блідо-жовтої олії (15 мг, 11 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,09-8,02 (м, 3H), 7,38-7,27 (м, 6H), 7,00-6,96 (м, 2H), 4,65 (д, J=5,7 Гц, 2H), 3,87 (с, 3H); МСІЕР: m/z 391 ([M+H]<sup>+</sup>).

Таблиця І

Сполуки й характеризуючі їх дані

Сполука№	Структура	вид	т.пл. (°C)	МСІЕР+	<sup>1</sup> Н ЯМР <sup>1</sup>
1		Біла Тверда	144	284	δ 8,52 (с, 1H), 8,03-8,00 (м, 2H), 7,97 (д, J=5,9 Гц, 1H), 7,80-7,76 (м, 1H), 7,67-7,63 (м, 2H), 3,09 (с, 3H).
2		Блідо-жовта тверда	136-139	290	δ 8,00 (д, J=1,32 Гц, 1H), 7,81 (м, 2H), 7,69 (д, J=5,27 Гц, 1H), 7,18 (м, 1H), 3,37 (с, 3H).
3		Блідо-жовта тверда	158-162	314	δ 8,01 (д, J=9,22 Гц, 2H), 7,74 (д, J=5,27 Гц, 1H), 7,04 (д, J=9,23 Гц, 2H), 3,90 (с, 3H), 3,31 (с, 3H).
4		Біла тверда	147-150	318-321	δ 8,02 (д, J=8,9 Гц, 2H), 7,71 (д, J=5,27 Гц, 1H), 7,57 (д, J=8,90 Гц, 2H), 3,32 (с, 3H).
5		Жовта олія	-	391	<sup>1</sup> Н ЯМР (400 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,09-8,02 (м, 3H), 7,38-7,27 (м, 6H), 7,00-6,96 (м, 2H), 4,65 (д, J=5,7 Гц, 2H), 3,87 (с, 3H).
6		Блідо-жовта тверда	163-166	298	δ 8,82 (м, 1H), 8,29 (д, J=6,8 Гц, 1H), 8,02 (дд, J=8,4, 1,1 Гц, 2H), 7,79 (ддд, J=6,9, 2,3, 1,1 Гц, 1H), 7,66 (дд, J=10,7, 4,9 Гц, 2H), 3,31 (кв, J=7,2 Гц, 2H), 1,09 (т, J=7,2 Гц, 3H), 4,9 Гц, 2H), 3,31 (кв, J=7,2 Гц, 2H), 1,09 (т, J=7,2 Гц, 3H).

Продовження таблиці I

Сполука№	Структура	вид	т.пл. (°C)	МСІЕР+	<sup>1</sup> Н ЯМР <sup>1</sup>
7		Блідо-жовта тверда	165-168	332	<sup>1</sup> Н ЯМР (400 МГц, ДМСО-d <sub>6</sub> +D <sub>2</sub> O (95:5)) δ 8,26 (д, J=6,7 Гц, 1Н), 8,04 (д, J=8,8 Гц, 2Н), 7,75 (д, J=8,8 Гц, 2Н), 3,33 (кв, J=7,3 Гц, 2Н), 1,09 (т, J=7,2 Гц, 3Н).
8		Блідо-жовта тверда	107-111	328	δ 8,75 (дд, J=7,2, 3,4 Гц, 1Н), 8,26 (д, J=6,8 Гц, 1Н), 7,96 (д, J=8,9 Гц, 2Н), 7,17 (д, J=9,0 Гц, 2Н), 3,87 (с, 3Н), 3,32 (кв, J=7,2 Гц, 2Н), 1,09 (т, J=7,2 Гц, 3Н).
9		Блідо-жовта тверда	182-185	366	<sup>1</sup> Н ЯМР (400 МГц, ДМСО-d <sub>6</sub> +D <sub>2</sub> O (95:5)) δ 8,29 (д, J=6,5 Гц, 1Н), 7,71 (м, 3Н), 3,35 (кв, J=7,2 Гц, 2Н), 1,11 (т, J=7,2 Гц, 3Н).

<sup>1</sup> Всі спектри знімали в ДМСО-d<sub>6</sub> при 300, 400 або 600 МГц, якщо не вказане інше.

Приклад 4: Оцінка фунгіцидної активності: плямистість листя пшениці (*Mycosphaerella graminicola*; анаморф: *Septoria tritici*; Байєрівський код SEPTTR)

- 5 Паростки пшениці (сорт Юма (Yuma)) вирощували з насіння в теплиці на суміші 50 % мінерального ґрунту/50 % суміші Метро (Metro) до повного розкриття першого листка, з 7-10 паростками на горщик. Ці рослини інокулювали водною емульсією спор *Septoria tritici* до або після обробок фунгіцидами. Після інокулювання рослини витримували при 100 % відносній вологості (один день у темній росяній камері, а потім два дні в освітленій росяній камері) для того, щоб спори могли розвинути й інфікувати листок. Потім рослини були перенесені в теплицю для розвитку захворювання.

- 10 Наступна таблиця показує активність типових сполук даного винаходу, оцінену в цих експериментах. Ефективність тестуючих сполук у придушенні захворювання визначали, оцінюючи серйозність (ступінь) захворювання оброблених рослин у відсотках до контрольного досліді, основанийому на рівні захворюваності в необроблених інокульованих рослинах.

У кожному випадку в Таблиці II шкала оцінок була наступною:

% приглушення захворювання	Рейтинг
76-100	А
51-75	Б
26-50	С
0-25	Д
Не тестовано	Е

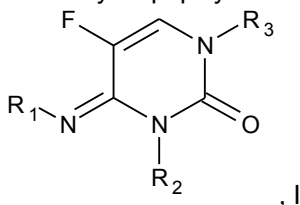
Таблиця II

Одноденний захист (1ДЗ) і триденна лікувальна (ЗДЛ) активність сполук стосовно SEPTTR при 100 мільйонних частках (м. ч.).

Сполука	SEPTTR 100 м. ч. 1ДЗ	SEPTTR 100 м. ч. ЗДЛ
1	А	А
2	А	А
3	А	А
4	А	А
5	Д	Д
6	Д	Д
7	Б	А
8	Д	Б
9	Д	А

# ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука формули



де R<sub>1</sub> означає Н;

R<sub>2</sub> означає:

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, необов'язково заміщений R<sub>4</sub>;

10 бензил, необов'язково заміщений 1-3 R<sub>5</sub>;

R<sub>3</sub> означає -S(O)<sub>2</sub>R<sub>6</sub>;

R<sub>4</sub> незалежно означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкілтіо, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкілкарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкіламінокарбоніл, гідроксил або C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>

15 триалкілсиліл;

R<sub>5</sub> незалежно означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкілтіо, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> діалкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

20 R<sub>6</sub> означає C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкіл, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> діалкіламіно, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sub>5</sub>, або 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, причому кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sub>5</sub>.

2. Композиція для боротьби з грибовими патогенами, яка включає сполуку за п. 1 і фітологічно прийнятний матеріал-носії.

25 3. Композиція за п. 2, де грибовим патогеном є яблучний струп (*Venturia inaequalis*), плямистість листя пшениці (*Septoria tritici*), листове ураження цукрового буряка (*Cercospora beticola*), листове ураження арахісу (*Cercospora arachidicola*) і чорна сигаток (*Mycosphaerella fijiensis*).

30 4. Спосіб пригнічення і запобігання грибовому ураженню рослини, що включає стадію: застосування фунгіцидно ефективної кількості принаймні однієї зі сполук за п. 1 до принаймні однієї рослини, ділянки, суміжної з рослиною, ґрунту, придатному до вирощування рослини, коріння рослини, листя рослини й насіння, придатного до проростання рослини.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

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

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