



УКРАЇНА

(19) UA (11) 92493 (13) C2

(51) МПК

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПОХІДНІ 2-ПІРИДИЛМЕТИЛЕНКАРБОКСАМІДУ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ

1

2

(21) a200713967

(22) 11.05.2006

(24) 10.11.2010

(86) PCT/EP2006/062232, 11.05.2006

(31) 05356079.3

(32) 13.05.2005

(33) EP

(31) 05356130.4

(32) 04.08.2005

(33) EP

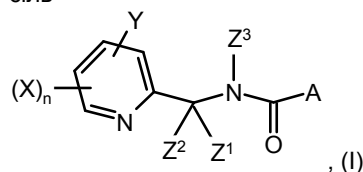
(46) 10.11.2010, Бюл.№ 21, 2010 р.

(72) ГЕРІ СТЕФАНІ, FR, ХІЛЛ БРАЙЕН, GB, ПЕРЕЗ
ЖОЗЕФ, FR, РАМА РАШЕЛЬ, FR, СПІКА ЖІЛЬ-
БЕРТ, FR, ВОР ЖАН-П'ЄР, FR

(73) БАЙЄР КРОПСАЙНС АГ, DE

(56) WO 0111966 A1, 22.02.2001

WO 0222583 A2, 21.03.2002

(57) 1. Сполука, що є похідною 2-
піридилметиленкарбоксаміду, формули (I) або її
сіль

в якій

А представляє заміщену чи не заміщену п'ятичленну гетероциклічну групу, приєднану до карбонілу через атом вуглецю;

Z¹ та Z², які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; C₁-C₅-алкіл; C₂-C₅-алкеніл; C₂-C₅-алкініл; ціаногрупу; нітрогрупу; атом галогену; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкенілокси; C₂-C₅-алкінілокси; C₃-C₇-циклоалкіл; C₁-C₅-алкілсульфеніл; аміногрупу; C₁-C₅-алкіламін; ді-C₁-C₅-алкіламін; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкілкарбамоїл; ді-C₁-C₅-алкілкарбамоїл; N-C₁-C₅-алкіл-C₁-C₅-алкоксикарбамоїл; абоZ¹ та Z² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, можуть утворити 3-, 4-, 5- або 6-

членне карбо- або гетероциклічне кільце, яке може бути заміщене;

Z³ представляє заміщений або не заміщений C₃-C₇-циклоалкіл;Y представляє C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;X може бути однаковим або різним і представляє атом галогену; нітрогрупу; ціаногрупу; гідроксил; карбоксильну групу; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₆-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламін; ді-C₁-C₈-алкіламін; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₆-галогеноалкокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілтіо; C₁-C₆-галогеноалкілтіо, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеноалкенілокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₈-алкінілокси; C₃-C₈-галогеноалкінілокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₈-циклоалкіл; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-алкілсульфеніл; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфеніл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-галогеноалкілсульфоніл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; або C₁-C₆-алкоксиміно-C₁-C₆-алкіл;

n=0, 1, 2 або 3;

а також солі, N-оксиди, комплекси металів, комплекси металоїдів та їх оптично активні ізомери.

2. Сполука за п. 1, в якій Z³ незаміщений.3. Сполука за п. 2, в якій Z³ представляє циклопропіл.

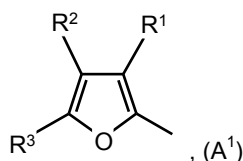
4. Сполука за пп. 1-3, в якій А вибраний з переліку, що складається з:

гетероциклу формули (A¹)

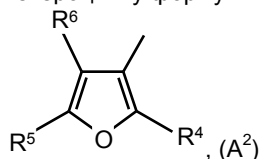
(13) C2

(11) 92493

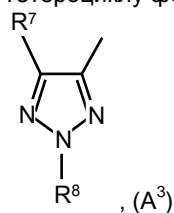
(19) UA



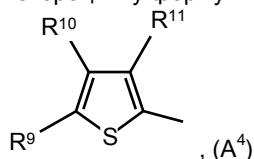
в якій:
замісники від R¹ до R³, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
гетероциклу формули (A²)



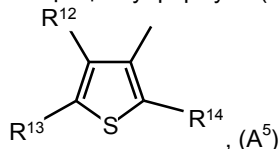
в якій:
замісники від R⁴ до R⁶, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
гетероциклу формули (A³)



в якій:
R⁷ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
R⁸ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;
гетероциклу формули (A⁴)



в якій:
замісники від R⁹ до R¹¹, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; амін; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілтіо або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
гетероциклу формули (A⁵)

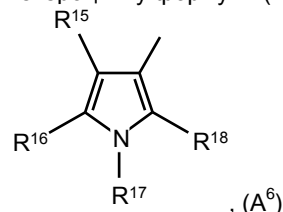


в якій:
R¹² та R¹³, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси, амін або C₁-C₅-

галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁴ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; амін або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A⁶)



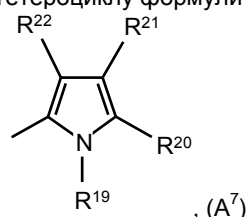
в якій:

R¹⁵ представляє атом водню; атом галогену; ціан; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁶ та R¹⁸, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁷ представляє атом водню або C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

гетероциклу формули (A⁷)

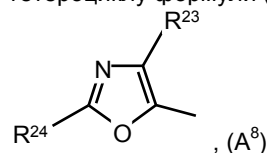


в якій:

R¹⁹ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

від R²⁰ до R²², які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню, атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

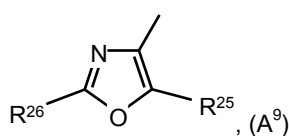
гетероциклу формули (A⁸)



в якій:

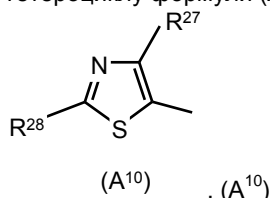
R²³ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R²⁴ представляє атом галогену або C₁-C₅-алкіл;
гетероциклу формули (A⁹)



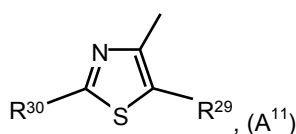
в якій:

R²⁵ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R²⁶ представляє атом галогену або C₁-C₅-алкіл; гетероциклу формули (A⁹)



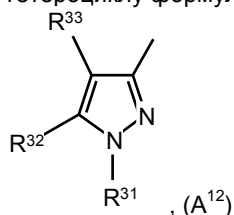
в якій:

R²⁷ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R²⁸ представляє атом водню; атом галогену; амін; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом; гетероциклу формули (A¹¹)



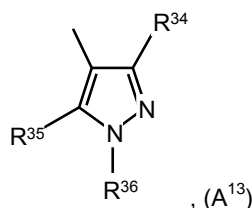
в якій:

R²⁹ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R³⁰ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін; C₁-C₅-алкіламін; ді-C₁-C₅-алкіламін; гетероциклу формули (A¹²)



в якій:

R³¹ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом; R³² представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R³³ представляє атом водню; атом галогену; нітрогрупу або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; гетероциклу формули (A¹³)

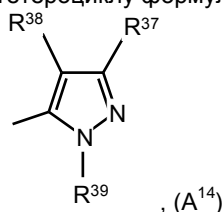


в якій:

R³⁴ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-циклоалкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкінілокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

R³⁵ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, ціаногрупу; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілітію; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін; C₁-C₅-алкіламін або ді(C₁-C₅-алкіл)амін; R³⁶ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

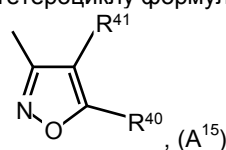
гетероциклу формули (A¹⁴)



в якій:

R³⁷ та R³⁸, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-алкілітію; R³⁹ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

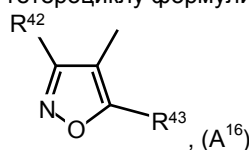
гетероциклу формули (A¹⁵)



в якій:

R⁴⁰ та R⁴¹, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A¹⁶)

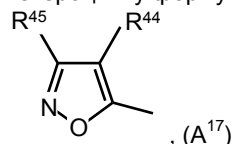


в якій:

R⁴² та R⁴³, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-

галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

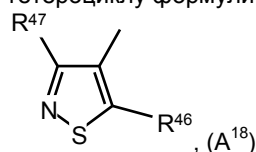
гетероциклу формули (A¹⁷)



в якій:

R⁴⁴ та R⁴⁵, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A¹⁸)

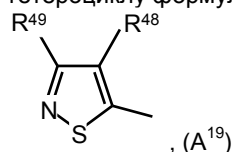


в якій:

R⁴⁶ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-алкілсульфаніл;

R⁴⁷ представляє атом водню; атом галогену або C₁-C₅-алкіл;

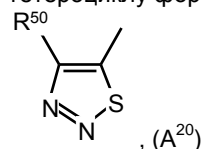
гетероциклу формули (A¹⁹)



в якій:

R⁴⁸ та R⁴⁹, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A²⁰)



в якій:

R⁵⁰ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

5. Сполука за п. 4, в якій А представляє гетероцикл формули (A¹³), як визначено вище, або в якій А представляє 5-членний гетероцикл, який заміщений в положенні орто.

6. Сполука за пп. 1-5, в якій Х, який може бути однаковим або різним, представляє атом галогену; C₁-C₈-алкіл або C₁-C₆-галогеноалкіл, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₆-галогеноалкокси, який містить до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

7. Сполука за пп. 1-6, в якій n=1.

8. Сполука за пп. 1-7, в якій Y представляє трифторметил.

9. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами в місцях зараження або можливого зараження цими грибами, який **відрізняється** тим, що до згаданих місць застосовують сполуки за пп. 1-7.

Даний винахід відноситься до похідних 2-піридил-метилен-карбоксаміду, способу їх приготування, їх використання як фунгіцидних активних агентів, зокрема, у формі фунгіцидних композицій, та методів контролю фітопатогенних грибів, зокрема, на рослинах, використовуючи ці сполуки або композиції.

В міжнародній патентній заявці WO-01/11966 деякі похідні 2-піридил-метилен-карбоксаміду охоплені взагалі в широкому розкритті численних сполук. Однак, цей документ не розкриває конкретно і не пропонує вибирати такі сполуки, в яких атом азоту залишку карбоксаміду міг би бути заміщений циклоалкілом.

В міжнародній патентній заявці WO-02/22583 розкриті деякі похідні, що містять азот.

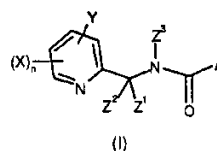
Однак, цей документ не розкриває і не пропонує, що такі сполуки, заміщені п'яти членними гетероциклічними групами, в яких атом азоту міг би бути заміщений циклоалкілом, може виявляти біологічну активність. Крім того, сполуки, розкриті цим документом, є систематично заміщеними двома А та В піридилними групами.

Завжди дуже цікавим у сільському господарстві є використання нових пестицидних сполук, щоб

запобігти або контролювати розвиток штамів, резистентних до активних інгредієнтів. Також дуже цікавим є використання нових сполук, які є більш активними, ніж вже відомі, з метою зменшення кількості активної сполуки, яку мають використовувати, в той же час підтримуючи ефективність, принаймні еквівалентну до вже відомих сполук.

Тепер ми знайшли нове сімейство сполук, яке має зазначені вище дії або переваги.

Відповідно, даний винахід забезпечує похідні 2-піридил-метилен-карбоксаміду формули (I):



в якій:

- А представляє заміщену або не заміщену п'яти членну гетероциклічну групу, приєднану до карбонілу через атом вуглецю;

- Z¹ та Z², які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл; C₂-C₅-алкеніл; C₂-C₅-алкініл; ціано-групу; нітро-групу; атом галогену; C₁-C₅- алкокси; C₂-C₅- алкенілокси;

C₂-C₅-алкінілокси; C₃-C₇-циклоалкіл; C₁-C₅-алкілсульфеніл; аміно-групу; C₁-C₅-алкіламін; ді-C₁-C₅-алкіламін; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкілкарбамоїл; ді-C₁-C₅-алкілкарбамоїл; N-C₁-C₅-алкіл-C₁-C₅-алкоксикарбамоїл; або

Z¹ та Z² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, можуть утворити 3-, 4-, 5- або 6-тичленне карбо- або гетероциклічне кільце, яке може бути заміщене;

- Z³ представляє заміщений або не заміщений C₃-C₇ циклоалкіл;

- Y представляє C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- X, який може бути однаковим або різним, представляє атом галогену; нітро-групу; ціано-групу; гідроксил; карбоксильну групу; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₆-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламін; ді- C₁-C₈-алкіламін; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₆-галогеноалкокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілтіо; C₁-C₆-галогеноалкілтіо, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеноалкенілокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₈-алкінілокси; C₃-C₈-галогеноалкінілокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₈-циклоалкіл; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-алкілсульфеніл; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфеніл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-галогеноалкілсульфоніл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₆-алкоксиміно-C₁-C₆-алкіл;

- n=0, 1, 2 або 3;

а також солі; N-окисли, комплекси металів, комплекси металоїдів та їх оптично активні ізомери.

Будь-яка зі сполук відповідно до винаходу може існувати в одній або більше оптичній чи хіральній формах залежно від кількості асиметричних центрів у сполуці. Таким чином, винахід стосується однаково всіх оптичних ізомерів та їх рацемічних або скалемічних сумішей (термін "скалемічні" позначає суміш енантіомерів у різних пропорціях), і сумішей всіх можливих стереоізомерів у всіх пропорціях. Діастереоізомери і/або оптичні ізомери можуть бути відокремлені відповідно до методів, які відомі спеціалістам даної галузі, які зазвичай мають з цим справу.

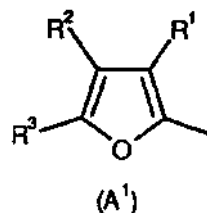
Будь-яка зі сполук відповідно до винаходу може також існувати в одній або більше геометричній ізомерній формі залежно від кількості подвійних зв'язків у сполуці. Таким чином, винахід стосується однаково всіх геометричних ізомерів і всіх можливих сумішей у всіх пропорціях. Геометричні ізомери можуть бути відокремлені відповідно до загальних методів, які відомі спеціалістам даної галузі, які мають з цим справу.

Для сполук відповідно до винаходу галоген означає один із фтору, броду, хлору або йоду, а гетероатомом може бути азот, кисень або сірка.

Кращими сполуками формули (I) відповідно до винаходу є ті, в яких представлений Z³ є не заміщений, зокрема, циклопропіл.

Іншими кращими сполуками формули (I) відповідно до винаходу є ті, в яких A вибраний з переліку, який складається з:

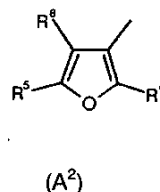
- гетероциклу формули (A¹)



в якій:

від R¹ до R³, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

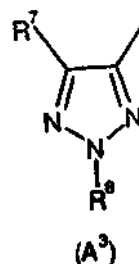
- гетероциклу формули (A²)



в якій:

від R⁴ до R⁶, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A³)

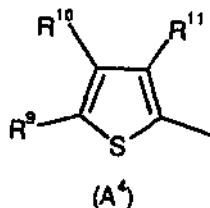


в якій:

R⁷ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁸ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або фенол, заміщений атомом галогену або C₁-C₆-алкілом;

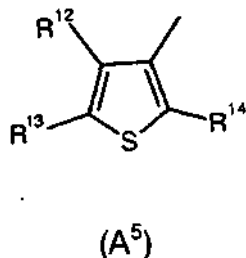
- гетероциклу формули (A⁴)



в якій:

від R⁹ до R¹¹, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; амін; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілтію або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A⁵)

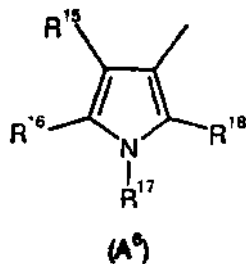


в якій:

R¹² та R¹³, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси, амін або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁴ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; амін або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A⁶)



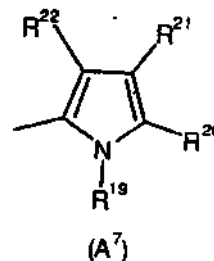
в якій:

R¹⁵ представляє атом водню; атом галогену; ціан; C₁-C₅-алкіл; або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁶ та R¹⁸, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁷ представляє атом водню або C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

- гетероциклу формули (A⁷)

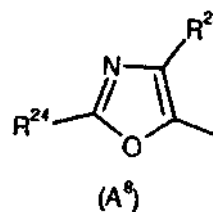


в якій:

R¹⁹ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

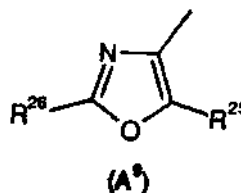
від R²⁰ до R²², які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню, атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A⁸)



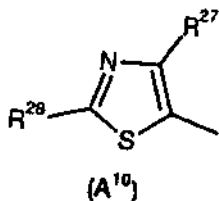
в якій:

R²³ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R²⁴ представляє атом водню або C₁-C₅-алкіл; гетероциклу формули (A⁹)



в якій:

R²⁵ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R²⁶ представляє атом водню або C₁-C₅-алкіл; - гетероциклу формули (A¹⁰)

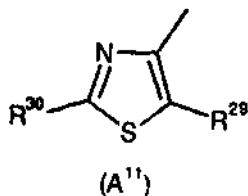


в якій:

R²⁷ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

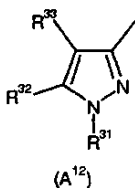
R²⁸ представляє атом водню; атом галогену; амін; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

- гетероциклу формули (A¹¹)



в якій:

R²⁹ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R³⁰ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін; C₁-C₅-алкіламін; ді-C₁-C₅-алкіламін;



- гетероциклу формули (A¹²)

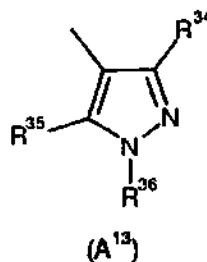
в якій:

R³¹ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

R³² представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³³ представляє атом водню; атом галогену; нітро-групу або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A¹³)



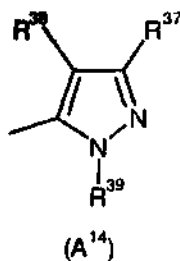
в якій:

R³⁴ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-циклоалкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкінілокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

R³⁵ представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, ціано-групу; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілтію; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін; C₁-C₅-алкіламін або ді(C₁-C₅-алкіл);

R³⁶ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

- гетероциклу формули (A¹⁴)

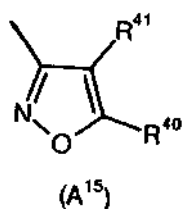


в якій:

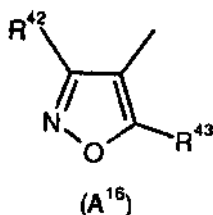
R³⁷ та R³⁸, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-алкілтію;

R³⁹ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;

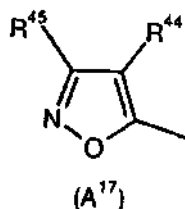
- гетероциклу формули (A¹⁵)



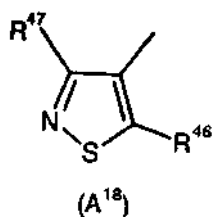
в якій:
R⁴⁰ та R⁴¹, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
- гетероциклу формули (A¹⁶)



в якій:
R⁴² та R⁴³, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; амін або феніл, заміщений атомом галогену або C₁-C₅-алкілом;
- гетероциклу формули (A¹⁷)

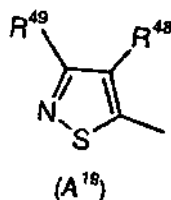


в якій:
R⁴⁴ та R⁴⁵, які можуть бути однаковими або різними, представляють атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
- гетероциклу формули (A¹⁸)

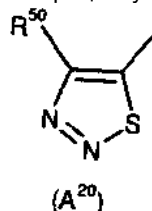


в якій:

R⁴⁶ представляє атом водню; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-алкілсульфаніл; R⁴⁷ представляє атом водню; атом галогену або C₁-C₅-алкіл;
- гетероциклу формули (A¹⁹)



в якій:
R⁴⁸ та R⁴⁹, які можуть бути однаковими або різними, представляє атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
- гетероциклу формули (A²⁰)



в якій:
R⁵⁰ представляє атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
- гетероциклу формули (A²¹)

Гетероцикл A¹³, зокрема, є кращим як замісник А для сполук відповідно до винаходу.

Деякими іншими кращими сполуками відповідно до винаходу є сполуки формули (I), в яких А представляє 5-ти членний гетероцикл, заміщений в положенні орто-. Такі сполуки можуть бути також визначені з А, яке представляє а-заміщений 5-ти членний гетероцикл.

Ще іншими кращими сполуками формули (I) відповідно до винаходу є ті, в яких Х, який може бути однаковим або різним, представляє атом галогену; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₆-галогеноалкіл, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₆-галогеноалкокси, який містить аж до 5 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

Ще іншими кращими сполуками формули (I) відповідно до винаходу є ті, в яких Y представляє трифторметил.

Ще іншими кращими сполуками формули (I) відповідно до винаходу є ті, в яких n дорівнює 1.

Зазначені вище переваги стосовно замісників сполук відповідно до винаходу можна комбінувати різними способами. Таким чином, ці комбінації кращих особливостей забезпечують підкласи сполук відповідно до винаходу. Приклади таких підкласів кращих сполук відповідно до винаходу можна комбінувати:

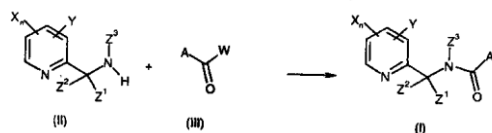
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³;

- кращі особливості А з кращими особливостями Y;
- кращі особливості А з кращими особливостями X;
- кращі особливості А з кращими особливостями n;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³ та Y;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³ та X;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³ та n;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³, Y та X;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³, Y та n;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³, X та n;
- кращі особливості А з кращими особливостями Z³, Y, X та n;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями Y;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями X;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями n;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями Y та X;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями Y та n;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями X та n;
- кращі особливості Z³ з кращими особливостями Y, X та n;
- кращі особливості Y з кращими особливостями X;
- кращі особливості Y з кращими особливостями n;
- кращі особливості Y з кращими особливостями X та n;

В цих комбінаціях кращих особливостей замісників сполук відповідно до винаходу згадані кращі особливості можна також вибрати серед найкращих особливостей кожного з Z³ та А так, щоб утворити найкращі підкласи сполук відповідно до винаходу.

Даний винахід також стосується способу приготування сполук формули (I).

Так, відповідно до подальшого аспекту відповідно до винаходу, забезпечений спосіб Р1 для приготування сполуки формули (I) і проілюстрований відповідно до наступної схеми реакції:



Спосіб Р1

в якій:

- А, Z¹, Z², Z³, X, n та Y є такими, як визначено тут;

- W представляє атом галогену або гідроксил.

Спосіб Р1 можна здійснити в присутності кислотної зв'язуючої речовини і в присутності розчинника.

Похідні сполуки аміну формули (II) відомі або їх можна приготувати відомими способами, наприклад, як описано в WO-01/11966, сторінки 20, 21 та 23.

Карбонові кислоти, хлориди кислот, броміди кислот або фториди кислот формули (III) відомі або їх можна приготувати відомими способами (WO-93/11117, сторінки 16-20; Nucleosides & Nucleotides, 1987, сторінки 737-759; Bioorg. Med. Chem. Lett., 2002, сторінки 2105-2108).

Зручними кислотними зв'язуючими речовинами для здійснення способу Р1 відповідно до винаходу можуть бути неорганічні або органічні основи, які продаються, для таких реакцій. Перевагу надають використанню гідроокисів лужноземельних металів або лужних металів, таким як гідроокис натрію, гідроокис кальцію, гідроокис калію, або іншим похідним гідроокису амонію; карбонатам лужних металів, таким як карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат натрію; бікарбонат калію; ацетатам лужних металів або лужноземельних металів, таким як ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію; а також четвертинним амінам, таким як триметиламін, тріетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, піридин, N-метилпіридин, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Можна також працювати у відсутності будь-яких додаткових кислотних зв'язуючих речовин.

Зручними розчинниками для здійснення способу Р1 відповідно до винаходу можуть бути інертні органічні розчинники, які є у продажу. Перевагу надають використанню не обов'язково галогенованих аліфатичних, аlicyclic або ароматичних вуглеводнів, таких як петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метил циклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид вуглецю (чотири хлористий вуглець), дихлоретан або трихлоретан; ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, метил т-бутиловий ефір, метил т-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан, 1,2-діетоксіетан або анізол; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил, p- або i-бутиронітрил або бензонітрил; аміді, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформамід, N-метилпірролідон або гексаметилфосфорний триамід; складні ефіри, такі як метил ацетат або етилацетат, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид, або сильфони, такі як сульфолан.

При здійсненні способу Р1 відповідно до винаходу температура реакції може змінюватись у відносно широких межах. Взагалі ці способи здійснюються при температурі від 0°C до 160°C, переважно від 10°C до 120°C. Шляхом контролювання температури способів відповідно до винаходу є використання мікрохвильової технології.

Спосіб Р1 відповідно до винаходу зазвичай здійснюють при атмосферному тиску. Можливо також оперувати при підвищеному або зниженому тиску.

При здійсненні способу Р1 відповідно до винаходу похідна сполука аміну формули (II) може бути використана у вигляді її гідрохлористої солі.

При здійсненні способу Р1 відповідно до винаходу 1 моль або надлишок похідної сполуки аміну формули (II) або від 1 до 3 молей кислотної з'вязуючої речовини можна використовувати на моль похідних кислоти (III).

Можна також використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях. Змішування здійснюються відомими методами.

Зазвичай реакційну суміш концентрують при зниженому тиску. Залишок, який залишається, може бути звільнений відомими методами, такими як хроматографія або рекристалізація, від будь-яких забруднень, які все ще можуть бути присутні.

Сполуки формули (I) відповідно до винаходу можна приготувати відповідно до описаних тут способів. Тим не менш має бути зрозумілим, що на базі своїх загальних знань і наявних публікацій працівники, які мають з цим справу, мають бути в змозі адаптувати ці способи відповідно до специфіки кожної зі сполук, які бажано синтезувати.

В іншому аспекті даний винахід також стосується фунгіцидної композиції, яка містить ефективно і не фітотоксичну кількість активної сполуки формули (I).

Вираз "ефективна і не фітотоксична кількість" означає кількість композиції відповідно до винаходу, яка є достатньою для контролю або руйнування гриба, присутнього або який може з'явитись на зернових культурах, і яка не спричиняє появу суттєвих симптомів фітотоксичності для згаданих зернових культур. Ця кількість може змінюватись в широких межах залежно від грибів, які мають контролюватись, типу зернової культури, кліматичних умов та сполук, які входять до складу фунгіцидної композиції відповідно до винаходу.

Цю кількість можна визначити шляхом систематичних польових випробувань, які є в межах можливостей спеціаліста даної галузі.

Таким чином, відповідно до винаходу забезпечена фунгіцидна композиція, яка містить, як активний інгредієнт, ефективну кількість сполуки формули (I), як визначено тут, і прийнятну у сільському господарстві допоміжну речовину, носій або наповнювач.

Відповідно до винаходу, термін "допоміжна речовина" позначає природну або синтетичну органічну чи неорганічну сполуку, з якою активна сполука формули (I) поєднана або зв'язана, щоб зробити легшим її застосування, зокрема, до частини рослини. Таким чином, ці допоміжні речовини зазвичай інертні і мають бути прийнятними у сільському господарстві. Допоміжна речовина може бути твердою або рідкою. Приклади зручних допоміжних речовин включають глини, природні або синтетичні силікати, кремнезем, смоли, віск, тверді добрива, воду, спирти, зокрема, бутанол, органічні розчинники, мінерали та рослинні олії та їх похідні речовини. Можна також використовувати суміші таких допоміжних речовин.

Композиція відповідно до винаходу може також містити додаткові компоненти. Зокрема, композиція може ще містити поверхнево-активну ре-

човину. Поверхнево-активна речовина може бути емульгатором, диспергувальним агентом або змочувальним агентом іонного чи не іонного типу, або сумішшю таких поверхнево-активних речовин. Слід зазначити, наприклад, солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової або нафталінсульфонової кислоти, поліконденсати етилен оксиду з жирними спиртами або з жирними кислотами, або з жирними амінами, заміщеними фенолами (зокрема, алкілфеноли або арилфеноли), солі складних ефірів сульфосукцинової кислоти, похідні таурину (зокрема, алкіл таурати), фосфорні складні ефіри поліоксетилованих алкохолів або фенолів, складні ефіри жирних кислот та поліолів, і похідні речовини присутніх сполук, які містять функціональні групи сульфату, сульфонату та фосфату. Присутність принаймні однієї поверхнево-активної речовини є зазвичай суттєвою тоді, коли активна сполука і/або інертна допоміжна речовина є не розчинними у воді і коли векторним агентом для застосування є вода. Переважно вміст поверхнево-активної речовини може становити від 5% до 40% за вагою від ваги композиції.

Не обов'язково можуть бути також уведений додаткові компоненти, наприклад, захисні колоїди, адгезиви, згущувачі, тиксотропні агенти, агенти для проникнення, стабілізатори, ізолюючі агенти. Більш загально, активні сполуки можуть бути поєднані з будь-якою твердою чи рідкою добавкою, яка узгоджується зі звичайними методиками утворення композицій.

Зазвичай композиція відповідно до винаходу може містити від 0,05 до 99% за вагою активної сполуки, переважно від 10 до 70% за вагою.

Композиції відповідно до винаходу можна використовувати в різних формах, таких як аерозольний розпилювач, суспензія в капсулах, концентрат для утворення холодного туману, придатний для розпилювання порошок, концентрат, придатний для виготовлення емульсії, емульсія олії у воді, емульсія води в олії, гранули, уміщені в капсули, дрібні гранули, текучі концентрати для обробки насіння, газ (під тиском), газогенеруючий продукт, гранули, концентрат для утворення теплого туману, макро гранули, мікро гранули, порошок, придатний для диспергування в олії, текучий концентрат, придатний для змішування з олією, рідина, придатна для змішування з олією, паста, рослинна паличка, порошок для сухої обробки насіння, насіння, покриті пестицидом, розчинний концентрат, розчинний порошок, розчин для обробки насіння, концентрат у вигляді суспензії (текучий концентрат), рідина з ультра малим об'ємом (ULV), суспензія з ультра малим об'ємом (ULV), гранули або таблетки, придатні для диспергування у воді, порошок, придатний для диспергування у воді, для обробки у вигляді шламу, гранули або таблетки, розчинні у воді, порошок, розчинний у воді, для обробки насіння, і змочуваний порошок.

Ці композиції включають не тільки композиції, які готові до застосування до рослин або насіння, які мають оброблятися за допомогою зручного пристрою, такого як розбризкувальний або розпилювальний пристрій, але також концентровані ко-

мерційні композиції, які мають бути розбавлені перед застосуванням до зернової культури.

Сполуки відповідно до винаходу можна також змішувати з одним або більше інсектицидом, фунгіцидом, бактерицидом, атрактантом, акарицидом (засобом для знищення кліщів) або активною субстанцією феромоном, або з іншими сполуками з біологічною активністю. Одержані таким чином суміші мають широкий спектр активності.

Зокрема, переважними є суміші з іншими фунгіцидними сполуками. Приклади зручних фунгіцидних партнерів для змішування можна вибрати з такого переліку:

B1) сполука, здатна перешкоджати синтезу нуклеїнової кислоти, така як беналаксил, беналаксил-М, бупіримат, ксиралаксил, клоцилаккон, диметиримол, етиримол, фуралаксил, хімексазол, метал аксил-М, офурас, оксациксил, оксолінова кислота;

B2) сполука, здатна перешкоджати мітозу та поділу клітини, така як беноміл, карбендазім, діетофенкарб, фуберідазол, пенсікурон, тіабендазол тіофанат-метил, зоксамід;

B3) сполука, здатна перешкоджати диханню, наприклад, як перешкода для C1-дихання, така як дифлуметорім;

як перешкода для CII-дихання, така як боскалід, карбоксин, фенфурам, флутоланил, фураметпір, мепроніл, оксикарбоксин, пентіопірад, тифлузамід;

як перешкода для CIII-дихання, така як азоксистробін, ціазофамід, димоксистробін, енестробін, фамоксадон, фенамідон, флуоксастробін, крезоксим-метил, метоміностробін, орізастробін, піраклостробін, пікоксистробін, трифлуксистробін;

B4) сполука, здатна діяти як роз'єднувач, така як динокап, флаузінам;

B5) сполука, здатна перешкоджати виробленню АТФ, така як фентин ацетат, фентин хлорид, фентин гідроксид, силтіофам;

B6) сполука, здатна перешкоджати біосинтезу АА та протеїну, така як андопрім, бластицидин-S, сипродиніл, казугаміцин, казугаміцин гідрохлорид гідрат, меланіпірим, піриметаніл;

B7) сполука, здатна перешкоджати сигнальній трансдукції, така як фенпіклоніл, флудіоксоніл, квінноксифен;

B8) сполука, здатна перешкоджати ліпідному та мембранному синтезу, така як хлоролінат, іпродіон, процимідон, вінклозолін, піразофос, едіфенфос, іпробенфос (IBP), ізопротіолан, толклофос-метил, біфеніл, йодокарб, пропамокарб, пропамокарб-гідрохлорид;

B9) сполука, здатна перешкоджати біосинтезу ергостеролу, така як фенгексамід, азаконазол, бітертанол, бромконазол, сипроконазол, диклобутразол, дифенокконазол, диніконазол, диніконазол-М, епоксиконазол, етаконазол, фенбуконазол, флуквіконазол, флузилазол, флутриафол, фуконазол, фуконазол-цис, гексаконазол, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, паклобутразол, пенконазол, пропіконазол, протіконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, тріадимефон, тріадименол, тритисоназол, уніконазол, вориконазол, імазалил, імазалил

сульфат, окспокконазол, фенаримол, флурпримідол, нуаримол, пірифенокс, трифорин, пефуразоат, прохлораз, трифлумізол, вініконазол, алдиморф, додеморф, додеморф ацетат, фенпропіморф, тридеморф, фенпропідин, спіроксамін, нафтифайн, пірибутикарб, тербінафін;

B10) сполука, здатна перешкоджати синтезу стінки клітини, така як бентіавалікарб, біалафос, диметоморф, флуморф, іпровалікарб, поліоксини, поліоксорим, валідаміцин А;

B11) сполука, здатна перешкоджати біосинтезу меланіну, така як карпропамід, диклоцимед, феноксаніл, фталид, піроквілон, трициклазол;

B12) сполука, здатна спричиняти захист хазяїна, така як ацибензолар-S-метил, пробеназол, тіадініл;

B13) сполука, здатна виявляти багатобічну дію, така як каптафол, каптан, хлороталоніл, препарати міді, такі як гідрооксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, суміш оксину міді та Bordeaux, дихлофлуанід, дитіанон, додин, додин вільна основа, фербам, фторофолпет, фолпет, квазатин, квазатин ацетат, іміноктадин, іміноктадин албесилат, іміноктадин триацетат, манкоппер, манкозеп, манеб, метирам, метирам цинк, пропінеб, сірка та препарати сірки, у тому числі полісульфід кальцію, тірам, толілфлуанід, цинеб, цирам;

B14) сполука, вибрана з такого переліку: амібромдол, бентіазол, бетоксазин, капзіміцин, карвон, хінометіонат, хлорпикрин, суфранеб, цифлуфенамід, цимоксаніл, дазомет, дебакарб, дикломезин, дихлорофен, диклоран, дифензоквіат, дифензоквіат метилсульфат, дифеніламін, етабоксам, феримзон, флуметовер, флусульфамід, фозетил-алюміній, фозетил-кальцій, фозетил-натрій, фторпіколід, фторимід, гексахлорбензол, 8-гідроксигінолін сульфат, ірумаміцин, метасульфоккарб, метрафенон, метил ізотіоціанат, мілдіоміцин, натаміцин, нікель диметилдитіокарбамат, нітротал-ізопропіл, октилінон, оксамокарб, оксифентин, пентахлорофенол та їх солі, 2-фенілфенол та його солі, фосфорна кислота та її солі, піпералін, пропаносин-натрій, прохіназид, піролінтрин, хінтозин, теклофталам, текназин, тріазоксид, трихлорамід, зариламід та 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)-піридин, N-(4-хлор-2-нітрофеніл)-N-етил-4-метил-бензолсульфонамід, 2-амін-4-метил-N-феніл-5-тіазолкарбоксамід, 2-хлор-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1 H-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксамід, 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметилізоксазолідин-3-іл]піридин, цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1 H-1,2,4-тріазол-1-іл)-циклогептанол, метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1 H-інден-1-іл)-1 H-імідазол-5-карбоксилат, 3,4,5-трихлор-2,6-піридиндикарбонітрил, метил-2-[[[циклопропіл(4-метоксифеніл)імін]метил]тіо]метил].альфа.-(метоксиметил)-бензолацетат, 4-хлор-альфа-пропінілокси-N-[2-[3-метокси-4-(2-пропінілокси)феніл]етил]-бензолацетамід, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорфеніл)-2-пропініл]окси]-3-метоксифеніл]етил]-3-метил-2-[(метилсульфоніл)амін]-бутанамід, 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-

трифторфеніл][1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфеніл)-N-[(1R)-1,2,2-триметилпропіл][1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин-7-амін, 5-хлор-N-[(1R)-1,2-диметилпропіл]-6-(2,4,6-трифторфеніл)[1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин-7-амін, N-[1-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2,4-дихлорнікотинамід, N-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)метил-2,4-дихлорнікотинамід, 2-бутокс-6-йод-3-пропіл-бензопіранон-4-он, N-[(2)-[(циклопропілметокси)імін][6-(диформетокси)-2,3-дифторфеніл]метил]-2-фенілацетамід, N-(3-етил-3,5,5-триметил-циклогексил)-3-форміламін-2-гідрокси-бензамід, 2-[[[1]-[3(1 фтор-2-фенілетил)окси]феніл]етиліден]амін]окси]метил]-альфа-(метоксиімін)-N-метил-альфаЕ-бензолацетамід, N-{2-[3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]етил}-2-(трифторметил)бензамід, N-(3',4'-дихлор-5-фторбіфеніл-2-іл)-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід, 2-(2-{[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпіримідин-4-іл]окси}феніл)-2-(метоксиімін)-N-метилацетамід, 1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропіл-1 Н-імідазол-1-карбонова кислота, О-[1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропіл]-1Н-імідазол-1-карботіонова кислота.

Композиція відповідно до винаходу, яка містить суміш сполуки формули (I) з бактерицидною сполукою, зокрема, також може бути кращою. Приклади зручних бактерицидних партнерів для суміші можна вибрати з такого переліку: бронопол, дихлорофен, нітрапірін, нікель диметилдитіокарбамат, казугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сульфат міді та інші препарати міді.

Сполуку формули (I) та фунгіцидну композицію відповідно до винаходу можна використовувати для цілющого або попереджувального контролю фітогенних грибів на рослинах або зернових культурах. Так, відповідно до ще одного аспекту винаходу, забезпечений спосіб цілющого або попереджувального контролювання фітопатогенних грибів на рослинах або зернових культурах, який відрізняється тим, що сполука формули (I) або фунгіцидна композиція відповідно до винаходу застосована до насіння, рослини або фрукту рослини, або до ґрунту, в якому вирощена рослина, або в якому бажано її вирощувати.

Спосіб обробки відповідно до винаходу може бути також корисним для обробки матеріалу, яким поширюється рослина, такого як клубні або кореневища, а також насіння, сіянці (розсада) або сходи насіння та рослини або рослинні сходи. Цей спосіб обробки може бути корисним також для обробки коріння. Спосіб обробки відповідно до винаходу може бути корисним також для обробки надземних частин рослини, таких як стовбур, стебла або пагони, листя, квіти та фрукти рослини, що розглядається.

Серед рослин, які можна захистити способом відповідно до винаходу, можна зазначити бавовну, льон, виноград, фрукти або овочеві культури, такі як *Rosaceae* sp. (наприклад, насіннячкові фрукти, такі як яблука та груші, але також кісточкові фрук-

ти, такі як абрикос, мигдаль та персик), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp., (наприклад, бананові дерева та плантації), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp., (наприклад, лимони, апельсини та грейпфрути); *Solanaceae* sp. (наприклад, томати), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (наприклад, салат-латук), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (наприклад, горох), *Rosaceae* sp. (наприклад, полуниці); головні зернові культури, такі як *Graminae* sp. (наприклад, маїс, газонні трави або хлібні злакові культури, такі як пшениця, рис, ячмінь та тритікале (гібрид пшениці та жита), *Asteraceae* sp. (наприклад, соняшник), *Cruciferae* sp. (наприклад, рапс), *Fabaceae* sp. (наприклад, арахіс), *Papilionaceae* sp. (наприклад, соя), *Solanaceae* sp. (наприклад, картопля), *Chenopodiaceae* sp. (наприклад, буряк), садові та лісові зернові культури; а також генетично модифіковані гомологи цих зернових культур.

Серед хвороб рослин або зернових культур, які можна контролювати за допомогою способу відповідно до винаходу, слід зазначити такі: Порошкові плісеневі хвороби, такі як: *Blumeria* хвороби, спричинені, наприклад, *Blumeria graminis*; *Podosphaera* хвороби, спричинені, наприклад, *Podosphaera leucotricha*; *Sphaerotheca* хвороби, спричинені, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*; *Uncinula* хвороби, спричинені, наприклад, *Uncinula necator* Хвороби іржавіння, такі як:

Gymnosporangium хвороби, спричинені, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*;

Hemileia хвороби, спричинені, наприклад, *Hemileia vastatrix*,

Phakopsora хвороби, спричинені, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomia*;

Puccinia хвороби, спричинені, наприклад, *Puccinia recondite*;

Uromyces хвороби, спричинені, наприклад, *Uromyces appendiculatus*; Оомусети хвороби, такі як:

Bremia хвороби, спричинені, наприклад, *Bremia lactucae*;

Peronospora хвороби, спричинені, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;

Phytophthora хвороби, спричинені, наприклад, *Phytophthora infestans*;

Plasmopara хвороби, спричинені, наприклад, *Plasmopara viticola*;

Pseudoperonospora хвороби, спричинені, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;

Pythium хвороби, спричинені, наприклад, *Pythium ultimum*; Хвороби на листі: плями, прищі, тля, такі як:

Alternaria хвороби, спричинені, наприклад, *Alternaria solani*;

Cercospora хвороби, спричинені, наприклад, *Cercospora beticola*;

Cladosporium хвороби, спричинені, наприклад, *Cladosporium cucumerinum*;

Cochliobolus хвороби, спричинені, наприклад, *Cochliobolus sativus*;

Colletotrichum хвороби, спричинені, наприклад, *Colletotrichum lindemuthianum*;

Cycloconium хвороби, спричинені, наприклад, *Cycloconium oleaginum*;

Diaporthe хвороби, спричинені, наприклад, *Diaporthe citri*;

Elsinoe хвороби, спричинені, наприклад, *Elsinoe fawcetti*;

Gloeosporium хвороби, спричинені, наприклад, *Gloeosporium laeticolor*,

Glomerella хвороби, спричинені, наприклад, *Glomerella cingulata*;

Guignardia хвороби, спричинені, наприклад, *Guignardia bidwelli*;

Leptosphaeria хвороби, спричинені, наприклад, *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;

Magnaporthe хвороби, спричинені, наприклад, *Magnaporthe grisea*;

Mycosphaerella хвороби, спричинені, наприклад, *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

Phaeosphaeria хвороби, спричинені, наприклад, *Phaeosphaeria nodorum*;

Pyrenophora хвороби, спричинені, наприклад, *Pyrenophora teres*;

Ramularia хвороби, спричинені, наприклад, *Ramularia collo-cygni*;

Rhynchosporium хвороби, спричинені, наприклад, *Rhynchosporium secalis*;

Septoria хвороби, спричинені, наприклад, *Septoria apii* або *Septoria lycopersici*;

Typhula хвороби, спричинені, наприклад, *Typhula incarnate*;

Venturia хвороби, спричинені, наприклад, *Venturia inaequalis*; Хвороби коріння та стебла, такі як:

хвороби кори, спричинені, наприклад, *Corticium graminearum*;

Fusarium хвороби, спричинені, наприклад, *Fusarium oxysporum*;

Gaeumannomyces хвороби, спричинені, наприклад, *Gaeumannomyces graminis*;

Rhizoctonia хвороби, спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;

Tapesia хвороби, спричинені, наприклад, *Tapesia acuformis*;

Thielaviopsis хвороби, спричинені, наприклад, *Thielaviopsis basicola*; Хвороби колосся та суцвіття у вигляді мітли, такі як:

Alternaria хвороби, спричинені, наприклад, *Alternaria* spp.;

Aspergillus хвороби, спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;

Cladosporium хвороби, спричинені, наприклад, *Cladosporium* spp.;

Claviceps хвороби, спричинені, наприклад, *Claviceps purpurea*;

Fusarium хвороби, спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;

Gibberella хвороби, спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;

Monographella хвороби, спричинені, наприклад, *Monographella nivalis*; Хвороби типу головні та мокрої головні, такі як:

Sphacelotheca хвороби, спричинені, наприклад, *Sphacelotheca reiliana*;

Tilletia хвороби, спричинені, наприклад, *Tilletia caries*;

Urocystis хвороби, спричинені, наприклад, *Urocystis occulta*;

Ustilago хвороби, спричинені, наприклад, *Ustilago nuda*; Хвороби гниття та плісняви фруктів, такі як:

Aspergillus хвороби, спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;

Botrytis хвороби, спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*;

Penicillium хвороби, спричинені, наприклад, *Penicillium expansum*;

Sclerotinia хвороби, спричинені, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*;

Verticillium хвороби, спричинені, наприклад, *Verticillium albo-atrum*; Хвороби у вигляді гниття насіння та ґрунту, плісняви, згуби квітів, розкладання та чорної ніжки:

Fusarium хвороби, спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;

Phytophthora хвороби, спричинені, наприклад, *Phytophthora cactorum*;

Puthium хвороби, спричинені, наприклад, *Puthium ultimum*;

Rhizoctonia хвороби, спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;

Sclerotium хвороби, спричинені, наприклад, *Sclerotium rolfsii*;

Microdochium хвороби, спричинені, наприклад, *Microdochium nivale*; Хвороби у вигляді червоточини, засихання вершин та мітел, такі як:

Nectria хвороби, спричинені, наприклад, *Nectria galligena*;

Тля або хвороби рослин, які призводять до припинення зростання рослини без загнивання, такі як:

Monilinia хвороби, спричинені, наприклад, *Monilinia laxa*;

Хвороби, при яких листя скручується або покривається пухирями, такі як:

Taphrina хвороби, спричинені, наприклад, *Taphrina deformans*;

Хвороби, при яких деревні рослини падають, такі як:

Esca хвороби, спричинені, наприклад, *Phaemoniella clamydospora*; Хвороби квітів та насіння, такі як:

Botrytis хвороби, спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*; Хвороби бульб, такі як:

Rhizoctonia хвороби, спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*.

Фунгіцидні композиції відповідно до винаходу можна також використовувати проти грибових захворювань, які мають схильність рости на або всередині деревини. Термін "деревина" означає всі типи порід дерев, та всі типи обробки цих дерев, призначені для конструкцій, наприклад, тверда деревина, деревина з високою щільністю, ламінована деревина та клеєна фанера. Спосіб

обробки деревини відповідно до винаходу головним чином полягає в контактуванні однієї або більше сполук відповідно до винаходу, або композиції відповідно до винаходу; це включає, наприклад, пряме застосування, розбризкування, впорскування або будь-який інший зручний засіб.

Доза активної сполуки, яку зазвичай застосовують в способі обробки відповідно до винаходу, становить взагалі і переважно від 10 до 800 г/га для застосування в обробці листя. Застосована доза активної субстанції взагалі і переважно становить від 2 до 200 г на 100 кг насіння, переважно від 3 до 150 г на 100 кг насіння у випадку обробки насіння.

Чітко зрозуміло, що дози, визначені тут, подані як ілюстративні приклади способу відповідно до винаходу. Спеціалісти даної галузі, які мають з цим справу, знають, як адаптувати дози застосування, зокрема, відповідно до природи рослини або надземної частини рослини, яку мають обробляти.

Фунгіцидна композиція відповідно до винаходу може бути також використана при обробці генетично модифікованих організмів сполуками відповідно до винаходу або агрохімічними композиціями відповідно до винаходу. Генетично модифікованими рослинами є рослини, в геном яких стабільно інтегрований гетерологічний ген, який кодує протеїн, яким цікавляться. Вираз "гетерологічний ген, який кодує протеїн, яким цікавляться", по суті означає гени, які надали трансформованій рослині нові агрономічні властивості, або гени для покращення агрономічної якості модифікованої рослини.

Композиції відповідно до винаходу можуть бути також використані для приготування композиції, корисної для цілющого або попереджувального

лікування грибкових захворювань людини чи тварини, таких як, наприклад, мікози, дерматози, грибок стригучого лишая та кандидози, або захворювань, спричинених *Aspergillus* spp., наприклад, *Aspergillus fumigatus*.

Різні аспекти винаходу тепер будуть ілюстровані з посиланням на наступні таблиці сполук і приклади. Наступні таблиці ілюструють не обмежувачим чином приклади сполук відповідно до винаходу.

В наступних прикладах M+1 (або M-1) означає пік молекулярного іону, плюс або мінус 1 а.м.у. (одиниця атомної маси) відповідно, як спостерігається в мас спектроскопії, а M (ArCl+) означає пік молекулярного іону, як було встановлено через хімічну іонізацію при позитивному атмосферного тиску в мас спектроскопії.

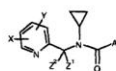
В наступних прикладах значення LogP були визначені у відповідності з ЕЕС Директивою 79/831, Додаток V.A8, за допомогою HPLC (Високоякісна рідинна хроматографія) на зворотно-фазній колонці (C 18), використовуючи метод, описаний нижче:

Температура: 40°C; рухливі фази: 0,1% водна мурашина кислота та ацетонітрил: лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу.

Калібрування здійснили, використовуючи не розгалужені алкан-2-один (які містять від 3 до 16 атомів вуглецю) з відомими значеннями LogP (визначення значень LogP при затриманих моментах часу, використовуючи лінійну інтерполяцію між двома наступними алканами).

Максимальні значення лямбди були визначені в максимумі хроматографічних сигналів, використовуючи спектр УФ від 190 нм до 400 нм.

Таблиця 1:














N°	A	Z1	Z2	X	Y	M+1	LogP
1		H	H	3-Cl	5-CF3		3,2
2		Me	H	3-Cl	5-CF3		3,6
3		H	H	3-Cl	5-CF3		3,78
4		Me	H	3-Cl	5-CF3		4,22
5		H	H	3-Cl	5-CF3	373	
6		H	H	3-Cl	5-CF3		4,28
7		Me	H	3-Cl	5-CF3		5,19

8		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3
9		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
10		H	H	3-Cl	5-CF ₃	487	
11		H	H	H	5-CF ₃		
12		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		5,09
13		CF ₃	H	3-Cl	5-CF ₃		
14		H	H	3-Cl	5-CF ₃	391	
15		H	H	3-Cl	5-CF ₃		4,17
16		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		4,95
17		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,55
18		H	H	3-Cl	5-CF ₃	444	












19		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
20		H	H	3-Cl	5-CF ₃		2,85
21		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		3,22
22		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,11
23		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		3,46
24		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
25		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,86
26		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,41
27		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		4,34
28		H	H	3-Cl	5-CF ₃	410	
29		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,15

31

92493

30		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		4,80
31		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
32		H	H	3-Cl	5-CF ₃	373	
33		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		3,15
34		H	H	3-Cl	5-CF ₃	409	
35		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		3,78
36		CF ₃	H	3-Cl	5-CF ₃		
37		H	H	6-Cl	4-CF ₃		3,1
38		H	H	3-Cl	5-CF ₃	405	
39		H	H	3-Cl	5-CF ₃		2,43
40		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		

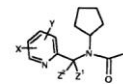
32

41		H	H	3-Cl	5-CF ₃		3,26
42		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		4,01
43		H	H	3-Cl	5-CF ₃		2,82
44		H	H	3-Cl	5-CF ₃	423	
45		H	H	3-Cl	5-CF ₃	391	
46		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		3,67
47		Et	H	6-Cl	4-CF ₃		2,95
48		CO ₂ Me	H	3-Cl	5-CF ₃		2,83
49		H	H	H	5-CF ₃		
50		H	H	3-Cl	5-CF ₃	445	
51		Me	H	3-Cl	5-CF ₃		

52		Et	H	3-Cl	5-CF ₃		
53		CF ₃	H	3-Cl	5-CF ₃		
54		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
55		H	H	3-Cl	5-CF ₃	2,53	
56		Me	H	3-Cl	5-CF ₃	2,79	
57		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,92	
58		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,15	
59		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,11	
60		H	H	3-Cl	5-CF ₃	2,75	
61		H	H	3-Cl	5-CF ₃	499	
62		H	H	3-Cl	5-CF ₃	373	

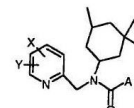
63		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,55	
64		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,32	
65		Me	H	3-Cl	5-CF ₃	3,63	
66		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
67		H	H	3-Cl	5-CF ₃	360	
68		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3	
69		H	H	3-Cl	5-CF ₃	4,48	
70		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
71		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,72	
72		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
73		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
74		H	H	3-Cl	5-CF ₃	430	

Таблица 2:



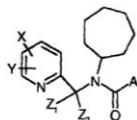
N°	A	Z1	Z2	X	Y	M+1	LogP
75		H	H	3-Cl	5-CF ₃	389	
76		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
77		H	H	3-Cl	5-CF ₃	419	
78		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
79		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,68	
80		H	H	3-Cl	5-CF ₃	3,32	
81		H	H	3-Cl	5-CF ₃	4,25	
82		H	H	3-Cl	5-CF ₃	4,15	

Таблица 3:



N°	A	Z1	Z2	X	Y	M+1	LogP
83		H	H	3-Cl	5-CF ₃	5,9	
84		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
85		H	H	3-Cl	5-CF ₃	475	
86		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
87		H	H	3-Cl	5-CF ₃	493	
88		H	H	3-Cl	5-CF ₃	473	
89		H	H	3-Cl	5-CF ₃	510	
90		H	H	3-Cl	5-CF ₃	510	

Таблиця 4:



N°	A	Z ¹	Z ²	X	Y	M _r	LogP
91		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
92		H	H	3-Cl	5-CF ₃	447	
93		H	H	3-Cl	5-CF ₃	464	
94		H	H	3-Cl	5-CF ₃	445	
95		H	H	3-Cl	5-CF ₃		
96		H	H	3-Cl	5-CF ₃	482	

Наступні приклади ілюструють не обмежувачим чином приготування та ефективність сполук формули (I) відповідно до винаходу.

Приклад приготування: N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил)-N-циклопропіл-5-фтор-1,3-диметил-1 Н-піразол-4-карбоксамід (сполука 45)

Розчин 2,7 г (10,7 ммоль) N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил) циклопропіламіну, 1,9 г (10,7 ммоль) 5-фтор-1,3-диметил-1 Н-піразол-4-карбоніл хлориду та 3,0 мл (21,5 ммоль) тріетиламіну в THF (60 мл) збовтали при кімнатній температурі впродовж 1 години.

Розчинник видалили під зменшеним тиском. Залишок розподілили між водним розчином соляної кислоти і етилацетатом. Органічну фазу відокремили, промили водним розчином карбонату калію, висушили над сульфатом магнію, і розчинник випарили. Одержану в результаті в'язку олію розчинили в гептані і після 2 хвилин виділилась тверда біла речовина, яку відфільтрували і висушили, одержавши 3,45 г бажаного N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил)-N-циклопропіл-5-фтор-1,3-диметил-1 Н-піразол-4-карбоксаміду у вигляді твердої білої речовини. Мас спектр: [M+1] = 391

Приклад А ефективності: тест in vivo на *Leptosphaeria* (плями на листях пшениці)

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилформаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою ефіру алкіларил полігліколь

Для того, щоб приготувати зручний препарат активної сполуки, 1 частину за вагою активної сполуки змішали з визначеними кількостями розчин-

ника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Молоді рослини обприскали препаратом активної речовини при встановленій швидкості застосування. Після того, як покриття спрею висохло, рослини були обприскані суспензією спор *Leptosphaeria nodorum*. Рослини залишили впродовж 48 годин в інкубаційній камері при 20°C і відносній вологості атмосфери 100%. Рослини умістили в теплицю при температурі приблизно 22°C і відносній вологості атмосфери, що становила приблизно 100%.

Тест оцінили через 12-14 днів після інокуляції (уведення живих мікроорганізмів в організм рослини). За цих умов від хорошого (принаймні 70% від стандарту хвороби) до повного захисту (100% стандарту хвороби) спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ з такими сполуками: від 45 до 50 відповідно до винаходу, в той час як від поганого захисту (менший ніж 30% від стандарту захворювання) до повної відсутності захисту спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ зі сполуками прикладів 2, 8 та 50, розкритих в патентній заявці WO-01/11966. Приклади 2,8 та 50, розкриті в патентній заявці WO-01/11966, відповідають, відповідно, таким сполукам: N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил)тіофен-2-карбоксамід N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил)-1-феніл-5-(трифторметил)-1Н-піразол-4-карбоксамід 2-бром-N-([3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл]метил)-4-(трифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксамід.

Ці результати показують, що сполуки відповідно до винаходу мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі сполуки, розкриті у WO-01/11966.

Приклад В ефективності: тест in vivo на *Erysiphe graminis* (порошкова пліснява на ячмені)

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилформаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларил полігліколь ефіру

Для того, щоб приготувати зручний препарат активної сполуки, 1 частину за вагою активної сполуки змішали з визначеними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для того, щоб тестувати захисну активність, молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при визначеній швидкості застосування. Після того, як набризкане покриття висохло, рослини обсіпали спорами *Erysiphe graminis* f.sp. hordey. Рослини умістили в теплицю при температурі приблизно 18°C і відносній вологості атмосфери приблизно 70%, щоб стимулювати розвиток пустул плісняви.

Тест оцінили через 7 днів після інокуляції. За цих умов від хорошого (принаймні 70% стандартного захворювання) до повного захисту (100% стандартного захворювання) спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ з такими сполуками: 45 та 50 відповідно до винаходу, в той час як поганий захист (менше ніж 30% від стандартного захворювання) до повної відсутності захисту спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ зі сполуками прикладів 2,8 та 50, розкритих в патентній заявці WO-01/11966.

Крім того, це підтверджує, що сполуки відповідно до винаходу мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі сполуки, розкриті в WO-01/11966.

Приклад С ефективності: тест *in vivo* на *Rugophora teres* (сітчасті плями на ячмені)

Розчинник: 10% за об'ємом ацетону 5% за об'ємом диметилсульфоксиду 85% за об'ємом води

Емульгатор: потроєний 80:0,5 мкл на мг а.і.

Активні інгредієнти випробування змішали з підходящою кількістю розчинника та емульгатора, щоб одержати бажану концентрацію активного матеріалу.

Рослини ячменю (вид Express або Plaisant) в чашці для закваски, висіяні на субстраті 50/50 торф'яного ґрунту Пуцолан і вирощені при 12°C, оброблені на листі 1-стадії (висотою 10 см) шляхом обприскування водною суспензією, описаною вище. Рослини, використані як контрольні, оброблені водним розчином, який не містить активного матеріалу.

Через 24 години рослини були заражені обприскуванням їх водною суспензією спор *Rugophora teres* (12000 спор на мл). Спори були зібрані з культури у віці 12 днів. Заражені рослини ячменю інкубували впродовж 24 годин при температурі приблизно 20°C і при 100% відносній вологості, а потім впродовж 12 днів при відносній вологості 80%.

Атестацію здійснили через 12 днів після зараження, порівняно з контрольними рослинами. За цих умов від хорошого (принаймні 70%) до повного захисту спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ з такими сполуками: 5,6,7,12,15,16,27,30,35,37,42, 45, 46,47,50 та 55.

Приклад D ефективності: тест *in vivo* на *Ruccinia recondita* f. Sp. Triticum (бура іржавиння пшениці) Розчинник: 10% за об'ємом ацетону 5% за об'ємом диметилсульфоксиду 85% за об'ємом води

Емульгатор: потроєний 80:0,5 мкл на мг а.і.

Активні інгредієнти випробування змішали з підходящою кількістю розчинника та емульгатора, щоб одержати бажану концентрацію активного матеріалу.

Рослини пшениці (вид Scipion) в чашці для закваски, висіяні на субстраті 50/50 торф'яного ґрунту

Пуцолан і вирощені при 12°C, оброблені на листі 1-стадії (висотою 10 см) шляхом обприскування водною суспензією, описаною вище. Рослини, використані як контрольні, оброблені водним розчином, який не містить активного матеріалу.

Через 24 години рослини були заражені обприскуванням їх водною суспензією спор *Ruccinia recondita* f. so. tritici (100000 спор на мл). Спори були зібрані з культури у віці 10 днів. Заражені рослини пшениці інкубували впродовж 48 годин при температурі приблизно 20°C і при 100% відносній вологості, а потім впродовж 10 днів при відносній вологості 80%.

Атестацію здійснили через 10 днів після зараження, порівняно з контрольними рослинами. За цих умов від хорошого (принаймні 60%) до повного захисту спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ з такими сполуками: 5, 26, 45 та 50.

Приклад E ефективності: тест *in vivo* на *Alternaria brassicae* (плями хрестоносця на листі)

Розчинник: 10% за об'ємом ацетону

5% за об'ємом диметилсульфоксиду 85% за об'ємом води

Емульгатор: потроєний 80:0,5 мкл на мг а.і.

Активні інгредієнти випробування змішали з підходящою кількістю розчинника та емульгатора, щоб одержати бажану концентрацію активного матеріалу.

Рослини редиски (вид Pernot) в чашці для закваски, висіяні на субстраті 50/50 торф'яного ґрунту Пуцолан і вирощені при 18-20°C, були оброблені на стадії сім'ядолі шляхом обприскування водною суспензією, описаною вище.

Рослини, використані як контрольні, були оброблені водним розчином, який не містить активного матеріалу.

Через 24 години рослини були заражені обприскуванням їх водною суспензією спор *Alternaria brassicae* (40000 спор на см³). Спори були зібрані з культури у віці 12-13 днів. Заражені рослини редиски інкубували впродовж 67 днів при температурі приблизно 18°C при вологій атмосфері.

Атестацію здійснили через 6-7 днів після зараження, порівняно з контрольними рослинами. За цих умов від хорошого (принаймні 70%) до повного захисту спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ з такими сполуками: 6,7, 12, 16, 23, 27, 30, 35, 42, 46, 50 та 56.