



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **106889** (13) **C2**
(51) МПК (2014.01)
C07D 339/00

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: а 2012 02731	(72) Винахідник(и): Бібель Тімоті (US), Брайан Крісті (US), Лорсбах Бет (US), Мартін Тімоті (US), Оуен В. (US), Побанс Марк (US), Торнберг Скотт (US), Вебстер Джеффри (US), Яо Ченьлінь (US)
(22) Дата подання заявки: 05.08.2010	
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 27.10.2014	
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 61/232,223	
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 07.08.2009	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: US	(73) Власник(и): ДАУ АГРОСАЙЕНСІЗ ЕЛЕЛСІ, 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054, United States of America (US)
(41) Публікація відомостей про заявку: 11.06.2012, Бюл.№ 11	(74) Представник: Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 27.10.2014, Бюл.№ 20	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: US 3368938 (A), 13.02.1968 WO 9733890 (A1), 18.09.1997 BERA S. ET AL.: "Nucleosides with furanyl scaffolds", TETRAHEDRON, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 58, no. 24, 10 June 2002, pages 4865-4871 DUSCHINSKY R. ET AL.: "Nucleosides. XXXIII. N4-Acylated 5-Fluorocytosines and a Direct Synthesis of 5-Fluoro-2'-deoxycytidine", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 9, no. 4, 1 July 1966, pages 566-572
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/US2010/044576, 05.08.2010	

(54) ПОХІДНІ N1-АЦИЛ-5-ФТОРПІРИМІДИНОНУ

(57) Реферат:

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

UA 106889 C2

Перехресне посилання на споріднені заявки

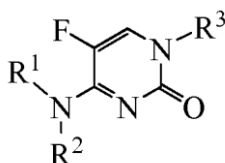
По даній заявці вимагається пріоритет згідно з попередньою патентною заявкою США з серійним номером 61/232223, поданою 7 серпня 2009 року.

Рівень техніки і суть винаходу

5 Фунгіциди являють собою сполуки природного або синтетичного походження, які діють шляхом захисту і/або лікування рослин від пошкодження, що викликається значущими в галузі сільського господарства грибами. Загалом, відсутній єдиний фунгіцид, придатний у всіх ситуаціях. Отже, продовжуються дослідження для отримання фунгіцидів, які можуть мати кращі характеристики, які легше застосовувати і які є дешевшими.

10 Даний винахід стосується сполук N1-ацил-5-фторпіримідинону і їх застосування як фунгіцидів. Сполуки за даним винаходом можуть забезпечити захист проти аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтероміцетів і ооміцетів.

Один з варіантів здійснення даного винаходу може включати сполуки формули I:



Формула I,

де R¹ являє собою:

H;

C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;

C₁-C₆алкеніл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;

C₃-C₆алкініл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;

феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R⁵, або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

-C(=S)R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; або

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

-C(=S)R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-S(O)₂R⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; або

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

де m являє собою ціле число, що дорівнює 1-3;

R² являє собою:

H; або

C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений R⁴;

альтернативно R¹ і R², взяті разом, можуть утворювати =CR¹¹N(R¹²)R¹³

R³:

-C(=O)R⁸; або

-C(=S)R⁸;

R⁴ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкілтіо, C₁-C₄галогеналкілтіо, аміно, галогентіо, C₁-C₃алкіламіно, C₂-C₆алкоксикарбоніл, C₂-C₆алкілкарбоніл, C₂-C₆алкіламінокарбоніл, гідроксил або C₃-C₆тріалкілсиліл;

R^5 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, C_2 - C_6 алкоксикарбоніл або C_2 - C_6 алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

R^6 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;

R^7 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 , або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатомів, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R^5 ;

R^8 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 , або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, що містить 1-3 гетероатомів, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R^5 ;

R^9 являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 , або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R^5 ;

R^{10} являє собою H, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, бензил, де бензил необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;

альтернативно R^9 і R^{10} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 ;

R^{11} являє собою H або C_1 - C_4 алкіл;

R^{12} являє собою H, ціано, гідроксил, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;

альтернативно R^{11} і R^{12} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 ;

R^{13} являє собою H, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ; і

альтернативно R^{12} і R^{13} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 .

Інший варіант здійснення даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для боротьби з ураженням грибами або його попередження, що містить сполуки, описані нижче, і фітологічно прийнятний носій.

Інший варіант здійснення даного винаходу може включати спосіб боротьби з ураженням грибами або його попередження на рослині, причому спосіб включає стадії нанесення фунгіцидно ефективною кількістю однієї або декількох сполук, описаної нижче, щонайменше на одне з гриба, рослини, площі, прилеглої до рослини, і насіння, адаптованого для виробництва 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 і т. п.

Термін "алкеніл" стосується розгалуженого, нерозгалуженого або циклічного вуглецевого ланцюга, що містить один або декілька подвійних зв'язків, включаючи етеніл, пропеніл, бутеніл, ізопропеніл, ізобутеніл, циклогексеніл і т. п.

Термін "алкініл" стосується розгалуженого або нерозгалуженого вуглецевого ланцюга, що містить один або декілька потрійних зв'язків, включаючи пропініл, бутиніл і т. п.

Як використовують в даному описі, термін "R" стосується групи, що складається з C_{2-8} алкілу, C_{3-8} алкенілу або C_{3-8} алкінілу, якщо немає інших вказівок.

Термін "алкокси" стосується замісника -OR.

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

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

Термін "алкілсульфоніл" стосується замісника $-SO_2-R$.

Термін "галогеналкілсульфоніл" стосується замісника $-SO_2-R$, де R повністю або частково заміщений Cl, F, I або Br або будь-якою їх комбінацією.

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

5 Термін "галогентіо" стосується сірки, заміщеної трьома або п'ятьма замісниками F.

Термін "галогеналкілтіо" стосується алкілтіо, який заміщений Cl, F, I або Br або будь-якою їх комбінацією.

Термін "алкіламінокарбоніл" стосується замісника $-C(O)-N(H)-R$.

Термін "діалкіламінокарбоніл" стосується замісника $-C(O)-NR^2$.

10 Термін "алкілциклоалкіламіно" стосується замісника циклоалкіламіно, який заміщений алкільною групою.

Термін "триалкілсиліл" стосується $-SiR_3$.

Термін "ціано" стосується замісника $-C\equiv N$.

Термін "гідроксил" стосується замісника $-OH$.

15 Термін "аміно" стосується замісника $-NH$.

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

Термін "діалкіламіно" стосується замісника $-NR_2$.

Термін "алкоксіалкокси" стосується $-O(CH_2)_nO(CH_2)_mCH_3$, де n дорівнює 1-3, і m дорівнює 0-2.

20 Термін "алкоксіалкіл" стосується алкоксизаміщення алкілу.

Термін "галогеналкоксіалкіл" стосується алкоксизаміщення алкілу, який повністю або частково заміщений Cl, F, I, або Br або будь-якою їх комбінацією.

Термін "гідроксіалкіл" стосується алкілу, який заміщений гідроксильною групою.

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

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

Термін "галогеналкеніл" стосується алкенілу, який заміщений Cl, F, I або Br або будь-якою їх комбінацією.

30 Термін "галогеналкініл" стосується алкінілу, який заміщений Cl, F, I або Br або будь-якою їх комбінацією.

Термін "галоген" або "гало" стосується одного або декількох атомів галогену, що визначаються як F, Cl, Br і I.

Термін "гідроксикарбоніл" стосується замісника $-C(O)-OH$.

35 Термін "нітро" стосується замісника $-NO_2$.

Протягом опису вказування на сполуку формули I також має на увазі включення оптичних ізомерів і солей формули I і їх гідратів. Зокрема, коли формула I містить розгалужену алкільну групу, зрозуміло, що такі сполуки включають їх оптичні ізомери і рацемати. Ілюстративні солі включають: гідрохлорид, гідробромід, гідройодид і т. п. Крім того, сполуки формули I можуть включати таутомерні форми.

Деякі сполуки, описані в даному документі, можуть існувати як один або декілька ізомерів. Фахівцям в даній галузі буде зрозуміло, що один ізомер може бути більш активним, ніж інші. Структури, описані в даному описі, зображені тільки в одній геометричній формі для ясності, однак мають на увазі, що вони відображають всі геометричні і таутомерні форми молекули.

45 Також фахівцям в даній галузі зрозуміло, що допустиме додаткове заміщення, якщо немає інших вказувань, при умові, що задовольняються правила утворення хімічних зв'язків і енергії напруження, і продукт все ще виявляє фунгіцидну активність.

Інший варіант здійснення даного винаходу стосується застосування сполуки формули I для захисту рослини від ураження фітопатогенним організмом або лікування рослини, зараженої фітопатогенним організмом, що включає нанесення сполуки формули I або композиції, що містить сполуку, на ґрунт, рослину, частини рослини, листя і/або насіння.

Крім того, інший варіант здійснення даного винаходу стосується композиції, придатної для захисту рослини від ураження фітопатогенним організмом і/або лікування рослини, зараженого фітопатогенним організмом, що містить сполуку формули I і фітологічно прийнятний носій.

55 Додаткові ознаки і переваги даного винаходу стануть очевидними фахівцям в даній галузі після розгляду наступного докладного опису ілюстративних варіантів здійснення, що ілюструють найкращий спосіб здійснення винаходу, як описано в даному документі.

Докладний опис даного винаходу

60 Сполуки за даним винаходом можна застосовувати будь-яким з множини відомих способів, або як сполуки, або як композиції, що містять сполуки. Наприклад, сполуки можна наносити на

коріння, насіння або листя рослин для боротьби з різними грибами, без несприятливого впливу на комерційну цінність рослин. Матеріали можна застосовувати в формі будь-якого з типів композицій, що звичайно використовуються, наприклад, як розчини, пилоподібні порошки, змочувані порошків, текучі концентрати або емульговані концентрати.

5 Переважно, сполуки за даним винаходом застосовують в формі композиції, що містить одну або декілька сполук формули I з фітологічно прийнятним носієм. Концентровані композиції для застосування можуть бути дисперговані у воді або інших рідинах або композиції можуть бути в формі пилоподібних порошків або гранул, які потім можна застосовувати без подальшої обробки. Композиції можна отримувати способами, які є загальноприйнятими в галузі

10 агрохімікатів.
Даний винахід передбачає всі носії, які можна включати до складу композиції з однією або декількома сполуками для доставки і застосування як фунгіциду. Як правило, композиції застосовують як водні суспензії або емульсії. Такі суспензії або емульсії можна отримувати з розчинних у воді, суспендованих у воді або емульгованих композицій, які являють собою тверді речовини, звичайно відомі як змочувані порошки; або рідини, звичайно відомі як емульговані концентрати, водні суспензії або суспензійні концентрати. Як буде добре зрозуміло, можна використати будь-який матеріал, до якого можуть бути додані ці сполуки, при умові, що він забезпечує бажану застосовність без істотного перешкоджання активності цих сполук як протигрибкових засобів.

20 Змочувані порошки, які можуть бути пресовані в форму диспергованих у воді гранул, містять однорідну суміш однієї або декількох сполук формули I, інертний носій і поверхнево-активні речовини. Концентрація сполуки в змочуваному порошку може складати від приблизно 10 процентів до приблизно 90 процентів по масі з розрахунку на загальну масу змочуваного порошку, більш переважно від приблизно 25 процентів по масі до приблизно 75 процентів по масі. При виготовленні композицій змочуваних порошків сполуки можна об'єднувати з будь-якою тонкоподрібненою твердою речовиною, такою як профіліт, тальк, крейда, гіпс, фулерова земля, бентоніт, атапульгіт, крохмаль, казеїн, глютен, монтморилонітові глини, діатомітова земля, очищені силікати або схожі з ними. При таких діях, тонко подрібнений носій і поверхнево-активні речовини, як правило, змішують із сполукою(ами) і подрібнюють.

30 Емульговані концентрати сполук формули I можуть містити прийнятну концентрацію, таку як від приблизно 10 процентів по масі до приблизно 50 процентів по масі сполуки в придатній рідині, з розрахунку на загальну масу концентрату. Сполуки можна розчиняти в інертному носії, який являє собою або розчинник, що змішується з водою, або суміш органічних розчинників, що не змішуються з водою, і емульгаторів. Концентрати можна розбавляти водою і маслом з утворенням сумішей для обприскування в формі емульсій типу "масло-у-воді".

35 Придатні органічні розчинники включають ароматичні речовини, особливо нафталінові і олефінові частини нафти з високою температурою кипіння, такі як важкий ароматичний лігроїн. Також можна використати інші органічні розчинники, наприклад, терпенові розчинники, включаючи похідні розину, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон і комплексні спирти, такі як 2-етоксіетанол.

40 Емульгатори, які переважно можна використати для даного винаходу, можуть легко визначити фахівці в даній галузі, і вони включають різні неіонні, аніонні, катіонні і амфотерні емульгатори або суміш двох або більше емульгаторів. Приклади неіонних емульгаторів, придатних для отримання емульгованих концентратів, включають простий ефір поліалкіленгліколю і продукти конденсації алкіл- і арилфенолів, аліфатичних спиртів, аліфатичних амінів або жирних кислот з оксидом етилену, оксидами пропілену, такими як етоксіловані алкілфеноли і складні ефіри карбонових кислот, солюбілізовані поліолом або поліоксіалкіленом. Катіонні емульгатори включають четвертинні сполуки амонію і солі жирних амінів. Аніонні емульгатори включають розчинні в маслі солі (наприклад, кальцієва) алкіларилсульфонових кислот, розчинні в маслі солі або прості ефіри сульфатованого полігліколю і відповідні солі простого ефіру фосфатованого полігліколю.

50 Типові органічні рідини, які можна використовувати для отримання емульгованих концентратів сполук за даним винаходом, являють собою ароматичні рідини, такі як ксилільна, пропілбензолільна фракції; або змішані нафталінові фракції, мінеральні масла, заміщені ароматичні органічні рідини, такі як діоктилфталат; гас; діалкіламіди різних жирних кислот, зокрема, диметиламіди жирних гліколів і похідних гліколів, таких як н-бутиловий ефір, етиловий ефір або метиловий ефір діетиленгліколю і метиловий ефір метиленгліколю і т.п. Також для отримання емульгованого концентрату можна використати суміші двох або більше органічних рідин. Органічні рідини включають ксилільну і пропілбензолільну фракції, причому в деяких випадках найбільш переважним є ксиліл. Поверхнево-активні диспергуючі засоби звичайно

використовують в рідких складах і в кількості від 0,1 до 20 процентів по масі з розрахунку на загальну масу диспергуючого засобу з однією або декількома із сполук. Склади також можуть містити інші сумісні добавки, наприклад, регулятори росту рослин і інші біологічно активні сполуки, що використовуються в сільському господарстві.

5 Водні суспензії включають суспензії однієї або декількох нерозчинних у воді сполук формули I, диспергованих у водному носії в концентрації в діапазоні від приблизно 5 до приблизно 50 процентів по масі, з розрахунку на загальну масу водної суспензії. Суспензії отримують шляхом тонкого подрібнення однієї або декількох сполук і енергійного перемішування подрібненого матеріалу з носієм, що складається з води і поверхнево-активних речовин, вибраних з розглянутих вище типів. Також можна додавати інші компоненти, такі як неорганічні солі і синтетичні або природні камеді, для збільшення густини і в'язкості водного носія. Часто найбільш ефективним є подрібнення і змішування одночасно шляхом отримання водної суміші і гомогенізації її в пристрої, такому як піщаний млин, кульовий млин або гомогенізатор поршневого типу.

15 Водні емульсії включають емульсії одного або декількох нерозчинного у воді пестицидно активних інгредієнтів, емульгованих у водному носії в концентрації, як правило, в діапазоні від приблизно 5 до приблизно 50 процентів по масі, з розрахунку на загальну масу водної емульсії. Якщо пестицидно активний інгредієнт являє собою тверду речовину, його необхідно розчинити в придатному розчиннику, що не змішується з водою, перед виготовленням водної емульсії. 20 Емульсії отримують емульгуванням рідкого пестицидно активного інгредієнта або його розчину, що не змішується з водою, у водному середовищі, як правило, з додаванням поверхнево-активних речовин, які сприяють утворенню і стабілізації емульсії, як описано вище. Його часто виробляють за допомогою енергійного перемішування, що забезпечується змішувачами або гомогенізаторами з високою силою зсуву.

25 Сполуки формули I також можна застосовувати як гранульовані композиції, які особливо придатні для нанесення на ґрунт. Гранульовані композиції, як правило, містять від приблизно 0,5 до приблизно 10 процентів по масі, з розрахунку на загальну масу гранульованої композиції сполуки(к), диспергованої в інертному носії, який складається повністю або здебільшого з грубомеленого інертного матеріалу, такого як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або схожа речовина, що не дорого коштує. Такі композиції звичайно отримують розчиненням сполук в придатному розчиннику і нанесення їх на гранульований носій, якому попередньо був наданий відповідний розмір частинок, в діапазоні від приблизно 0,5 до приблизно 3 мм. Придатний розчинник являє собою розчинник, в якому сполука є по суті або повністю розчинною. Такі композиції також можна отримувати шляхом приготування тістоподібної маси або паст з носія і сполуки і розчинника, і подрібнення і сушіння з отриманням бажаних гранульованих частинок.

35 Пилоподібні порошки, що містять сполуки формули I, можна отримувати змішуванням в однорідну суміш однієї або декількох сполук в порошкової формі з придатним пилоподібним сільськогосподарським носієм, наприклад, таким як каолінова глина, подрібнена вулканічна порода і т. п. Пилоподібні порошки можуть належним чином містити від приблизно 1 до 40 приблизно 10 процентів по масі сполук, з розрахунку на загальну масу пилоподібного порошку.

Крім того, композиції можуть містити допоміжні поверхнево-активні речовини для посилення відкладення, змочування і проникнення сполук в задану сільськогосподарську культуру або організм. Ці допоміжні поверхнево-активні речовини необов'язково можна застосовувати як компонент композиції або як суміш в резервуарі. Кількість допоміжної поверхнево-активної речовини, як правило, варіює від 0,01 до 1,0 процента по об'єму з розрахунку на об'єм води для обприскування, переважно від 0,05 до 0,5 процента по об'єму.

45 Придатні допоміжні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються ними, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або природні спирти, солі складного ефіру або сульфобурштинових кислот, етоксировані органосилікони, етоксировані жирні аміни і суміші поверхнево-активних речовин з мінеральними маслами або рослинними оліями. Склади також можуть включати емульсії типу "масло-у-воді", такі як емульсії, описані в патентній заявці США з серійним номером 11/495228, зміст якої повністю включений в даний документ шляхом посилання.

55 Композиції необов'язково можуть включати комбінації, які містять інші пестицидні сполуки. Такі додаткові пестицидні сполуки можуть являти собою фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематодциди, мітициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні із сполуками за даним винаходом в носії, вибраному для нанесення, і не є антагоністами активності даних сполук. Таким чином, в таких варіантах здійснення використовують іншу пестицидну сполуку як додаткову токсичну речовину для того ж або відмінного пестицидного застосування. Сполуки

формули I і пестицидна сполука в комбінації можуть, головним чином, бути присутніми в масовому співвідношенні від 1:100 до 100:1.

Сполуки за даним винаходом також можна комбінувати з іншими фунгіцидами з утворенням їх фунгіцидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом часто застосовують разом з одним або декількома іншими фунгіцидами для боротьби з широкою множиною небажаних захворювань. При використанні разом з іншим фунгіцидом(ами), дані заявлені сполуки можна виготовляти з іншим фунгіцидом(ами), змішувати в резервуарі з іншим фунгіцидом(ами) або застосовувати послідовно з іншим фунгіцидом(ами). Такі інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатметилтіо)бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксихінолінсульфат, аметоктрадин, амісульбром, антимицин, *Ampelomyces quisqualis*, азокназол, азоксистробін, *Bacillus subtilis*, *Bacillus subtilis* штам QST713, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб-ізопропіл, бензилімінобензол-сульфонатна (BABS) сіль, бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, боракс, бордоська рідина, боскалід, бромукназол, бупіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, хлазафенон, хлоронеб, хлороталоніл, хлозолінат, *Coniothyrium minitans*, гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, сульфат міді (триосновний), оксид міді, ціазофамід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакарб, етиленбіс(дитіокарбамат) діамонію, дихлофлуанід, дихлорфен, диклоцимет, дикломезин, дихлоран, диетиофенкарб, дифенокназол, дифензокват-іон, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-M, динобутон, динокап, дифенілумін, дитіанон, додеморф, додеморфу ацетат, додин, вільна основа додину, едифенфос, енестробін, епоксикназол, етабоксам, етоксиквін, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентину ацетат, фентину гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, фторимід, флуоксастробін, флуквінконазол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, формальдегід, фосетил, фосетил-алюміній, фуберідазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатину ацетати, GY-81, гексахлорбензол, гексакназол, гімексазол, імазаліл, імазалілсульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадину триацетат, іміноктадину тріс(албесилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, ламінарин, казугаміцин, казугаміцину гідрохлориду гідрат, крезоксим-метил, манкупрум, манкозеп, мандипропамід, манеб, мепаніпірим, мепроніл, хлорид ртуті, оксид ртуті, хлорид одновалентної ртуті, металаксил, мефеноксам, мептил-динокап, металаксил-M, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, метконазол, метасульфоккарб, метилйодид, метилізотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіюміцин, міклобутаніл, набам, нітротал-ізопропіл, нуаримол, октилінон, офурейс, олеїнова кислота (жирні кислоти), орисастробін, оксидиксил, оксин міді, окспоконазолу фумарат, оксикарбоксин, перфурозат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенон, пентахлорфенілу лаурат, пентіопірад, ацетат фенілртуті, фосфонову кислоту, фталід, пікоксистробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, калію гідроксихіноліну сульфат, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарбу гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, проквіназид, протіокназол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, піриквілон, квінокламін, квіноксифен, квінтозен, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, седаксан, силтіофам, симеконазол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірку, SYP-Z071, SYP-Z048, дьогтеві масла, тебуконазол, тебуфлуквін, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тірам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолин, 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-тетрафторацетону гідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіїну 1,1,4,4-тетраоксид, ацетат 2-метоксіетилртуті, хлорид 2-метоксіетилртуті, силікат 2-метоксіетилртуті, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)фенілтіоціанат, ампропілфос, анілазин, азитирам, полісульфід барію, Bayer 32394, беноданіл, бенквінокс, бенталурон, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бінапакрил, сульфат біс(метилртуті), оксид біс(трибутилолова), бутіобат, кадмію кальцію міді цинку хромату сульфат, карбаморф, СЕСА, хлорбензіазон, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорквінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол, ципрофурам, декафентин, дихлон,

дихлозолін, диклобугтазол, диметиримол, диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритон, диталіфос, додизин, дразоксолон, EBP, ESBP, етаконазол, етем, етирим, фенаміносальф, фенапаніл, фенітропан, 5-фторцитозин і його профунгіциди, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс, фуорофанат, гліюдин, гризеофульвін, галакринат, Hercules 3944, гексилтіофос, ICIA0858, ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксолон, метфуороксам, диціандіамід метилртуті, метсульфовакс, мілнеб, мукохлористий ангідрид, міклозолін, N-3,5-дихлорфеніл-сукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилртуть-4-толуолсульфонанілід, біс(диметилдітіокарбамат) нікелю, OCH, диметилдітіокарбамат фенілртуті, нітрат фенілртуті, фосдифен, піколінамід UK-2A і його похідні, протіокарб; протіокарбу гідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксифлор, піроксифур, квінацетол; квінацетолу сульфат, квіназамід, квінконазол, рабензазол, саліциланілід, SSF-109, сультропен, текорам, тіадифлуор, тиціофен, тіохлорфенфін, тіофанат, тіоквінокс, тіоксимід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихламід, урбацід і заріламід і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки за даним винаходом можна комбінувати з іншими пестицидами, включаючи інсектициди, нематоциди, мітициди, артропоциди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні із сполуками за даним винаходом в носії, вибраному для нанесення, і не є антагоністами активності сполук за даним винаходом, з утворенням їх пестицидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом можна застосовувати разом з одним або декількома іншими пестицидами для боротьби з ширшою множиною небажаних паразитів. При використанні разом з іншими пестицидами заявлені сполуки за даним винаходом можна виготовляти з іншим пестицидом(ами), змішувати в резервуарі з іншим пестицидом(ами) або застосовувати послідовно з іншим пестицидом(ами). Типові інсектициди включають, але не обмежуються ними: антибіотичні інсектициди, такі як алосамідин і турингієнсин; інсектициди на основі макроциклічних лактонів, такі як спіносад і спінеторам; інсектициди на основі авермектину, такі як абамектин, дорамектин, емаектин, епріномектин, івермектин і селамектин; мілбеміцинові інсектициди, такі як лепімектин, мілбемектин, мілбеміцину оксим і моксидектин; миш'якові інсектициди, такі як арсенат кальцію, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, арсенат свинцю, арсеніт калію і арсеніт натрію; ботанічні інсектициди, такі як анабазин, азадирахтин, d-лімонен, нікотин, піретрини, цинерини, цинерин I, цинерин II, ясмолін I, ясмолін II, піретрин I, піретрин II, касія, ротенон, ріанія і сабадила; карбаматні інсектициди, такі як бендіокарб і карбарил; бензофуранілметилкарбаматні інсектициди, такі як бенфуракарб, карбофуран, карбосальфан, декарбофуран і фуратіокарб; диметилкарбамат інсектициди: димітан, диметилан, гиквінкарб і прімікарб; інсектициди на основі карбаматів оксимів, такі як аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, бутоксикарб, бутоксикарб, метоміл, нітрилакарб, оксаміл, тазимкарб, тіокарб, тіодикарб і тіофанокс; фенілметилкарбаматні інсектициди, такі як аліксикарб, амінокарб, буфенкарб, бутаккарб, карбанолат, клоетокарб, дикресил, діоксикарб, EMPC, етіофенкарб, фенетаккарб, фенобукарб, ізопрокарб, метіокарб, метоксикарб, мексикарбат, промазил, промеккарб, пропексур, триметаккарб, ХМС і ксиліларб; осушувальні інсектициди, такі як борна кислота, діатомітова земля і силікагель; діамідні інсектициди, такі як хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; динітрофенольні інсектициди, такі як дінекс, динопроп, диносам і DNOC; фторвмісні інсектициди, такі як гексафторсилікат барію, кріоліт, фторид натрію, гексафторсилікат натрію і сульфурамід; формамідинові інсектициди, такі як амітраз, хлордиформ, форметанат і формпаранат; дихальні інсектициди, такі як акрилонітрил, сірковуглець, тетрахлорметан, хлороформ, хлорпікрин, пара-дихлорбензол, 1,2-дихлорпропан, етилформіат, дібромід етилену, дихлорид етилену, оксид етилену, ціановодень, йодметан, метилбромід, метилхлороформ, метилхлорид, нафталін, фосфін, сульфурилфторид і тетрахлоретан; неорганічні інсектициди, такі як боракс, полісульфид кальцію, олеат міді, хлорид ртуті, тіоціанат калію і тіоціанат натрію; інгібітори синтезу хітину, такі як бістрифлуорон, бупрофезин, хлорфлуазурон, циромазин, дифлубензулон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлумурон, пенфлуорон, тефлубензулон і трифлумурон; міметики ювенільних гормонів, такі як епофенонан, феноксикарб, гідропрен, кінопрен, метопрен, пірипроксифен і трипрен; ювенільні гормони, такі як ювенільний гормон I, ювенільний гормон II і ювенільний гормон III; агоністи гормонів линяння, такі як хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид і тебуфенозид; гормони линяння, такі як α-екдизон і екдистерон; інгібітори линяння, такі як діофенолан; прекоцени, такі як прекоцен I, прекоцен II і прекоцен III; некласифіковані регулятори росту комах, такі як дицикланіл; інсектициди на основі аналогів нерістоксину, такі як бенсультап, картап, тіоциклам і тіоссультап; нікотиніодні інсектициди, такі як флонікамід; нітрогуанідинові інсектициди, такі як клотіанідин, динотефуран, імідаклоприд і тіаметоксам; нітрометиленові інсектициди, такі як нітенпірам і

нітіазин; піридилметиламінові інсектициди, такі як ацетаміприд, імідаклоприд, нітенпірам і тіаклоприд; хлорорганічні інсектициди, такі як бром-DDT, кафехлор, DDT, pp'-DDT, етил-DDD, HCH, гамма-HCH, ліндан, метоксихлор, пентахлорфенол і TDE; циклодієнові інсектициди, такі як алдрин, бромциклен, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, дієлдрин, дилор, ендосульфат, альфа-ендосульфат, ендрин, HEOD, гептахлор, HHDN, ізобензан, ізодрин, келеван і мірекс; фосфаторганічні інсектициди, такі як бромфенвінфос, хлорфенвінфос, кротоксифос, дихлорофос, дикротофос, диметилвінфос, фоспірат, гептенофос, метокротофос, мевінфос, монокротофос, налед, нафталофос, фосфамідон, пропафос, TEPP і тетрахлорвінфос; тіофосфаторганічні інсектициди, такі як діоксабензофос, фосметилан і фентоат; аліфатичні тіофосфаторганічні інсектициди, такі як ацетіон, амітон, кадусафос, хлоретоксифос, хлормефос, демефіон, демефіон-О, демефіон-S, деметон, деметон-О, деметон-S, деметон-метил, деметон-О-метил, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, дисульфотон, етіон, етопрофос, IPSP, ізотіоат, малатіон, метакрифос, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, форат, сульфотеп, тербуфос і тіометон; аліфатичні амідні фосфаторганічні інсектициди, такі як амідотіон, ціантоат, диметоат, етоат-метил, формотіон, мекарбам, ометоат, протоат, софамід і вамідотіон; інсектициди на основі фосфаторганічних оксимів, такі як хлорфоксим, фоксим і фоксим-метил; гетероциклічні тіофосфаторганічні інсектициди, такі як азаметифос, коумафос, коумитоат, діоксатіон, ендотіон, меназон, морфотіон, фосалон, піраклофос, піридафентіон і квінотіон; бензотіопіранові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як дитикрофос і тикрофос; бензотриазинові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як азинфос-етил і азинфос-метил; ізоіндолтіофосфаторганічні інсектициди, такі як діаліфос і фосмет; ізоксазолтіофосфаторганічні інсектициди, такі як ізоксатіон і золапрофос; піразолопіримідинові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як хлорпразофос і піразофос; піридинові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як хлорпірифос і хлорпірифос-метил; піримідинові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як бутатіофос, діазинон, етримфос, ліримфос, піриміфос-етил, піриміфос-метил, примідофос, піримітат і тебупіримфос; хіноксалінові тіофосфаторганічні інсектициди, такі як квіналфос і квіналфос-метил; тіадіазолтіофосфаторганічні інсектициди, такі як атидатіон, літидатіон, метидатіон і протидатіон; триазолтіофосфаторганічні інсектициди, такі як ісазофос і триазофос; фенілтіофосфаторганічні інсектициди, такі як азотоат, бромфос, бромфос-етил, карбофенотіон, хлортіофос, ціанофос, цитіоат, дикаптон, дихлофентіон, етафос, фамфур, фенхлорфос, фенітротіон, фунсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, гетерофос, йодфенфос, месульфенфос, паратіон, паратіон-метил, фенкаптон, фосніхлор, профенофос, протіофос, сульпрофос, темефос, трихлорметафос-3 і трифенфос; фосфонатні інсектициди, такі як бутонат і трихлорфон; фосфонотіоатні інсектициди, такі як мекарфон; фенілетилфосфонотіоатні інсектициди, такі як фонофос і трихлоронат; фенілфенілфосфонотіоатні інсектициди, такі як ціанофенфос, EPN і лептофос; фосфорамідатні інсектициди, такі як круфомат, фенаміфос, фостіетан, мефосфолан, фосфолан і піриметафос; фосфорамідотіоатні інсектициди, такі як ацефат, ізокарбофос, ізофенфос, ізофенфос-метил, метамідофос і пропетафос; фосфородіамідні інсектициди, такі як димефокс, мазидокс, міпафокс і шрадан; оксадіазинові інсектициди, такі як індоксакарб; оксадіазолінові інсектициди, такі як метоксадіазон; фталімідні інсектициди, такі як діаліфос, фосмет і тетраметрин; піразольні інсектициди, такі як тебуфенпірад, толефенпірад; фенілпіразольні інсектициди, такі як ацетопрол, етипрол, фіпроніл, пірафлупірол, пірипрол і ваніліпрол; інсектициди на основі піретроїдних складних ефірів, такі як акринатрин, алетрин, боалетрин, бартрин, біфентрин, біоетанометрин, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин, дельтаметрин, димефлутрин, диметрин, емпентрин, фенфлутрин, фенпіритрин, фенпропатрин, фенвалерат, есфенвалерат, флуцитринат, флувалінат, тау-флувалінат, фуретрин, іміпротрин, меперфлутрин, метофлутрин, перметрин, біоперметрин, трансперметрин, фенотрин, пралетрин, профлутрин, піресметрин, ресметрин, біоресметрин, цисметрин, тефлутрин, тералетрин, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тралометрин і трансфлутрин; інсектициди на основі піретроїдних простих ефірів, такі як етофенпрокс, флуфенпрокс, галфенпрокс, протрифенбут і силафлуофен; піримідинамінові інсектициди, такі як флуфенерим і піримідифен; пірольні інсектициди, такі як хлорфенапір; інсектициди на основі тетрамової кислоти, такі як спіротетрамат; інсектициди на основі тетранової кислоти, такі як спіромесифен; інсектициди на основі тіосечовини, такі як діафентиурон; інсектициди на основі сечовини, такі як флукофулон і сулькофулон; і некласифіковані інсектициди, такі як клосантел, нафтенат міді, кротамітон, EXD, феназафлор, феноксакрим, гідраметилнон, ізопротіолан, малонобен, метафлумізон, ніфлуридид, пліфенат, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, рафоксанід, сульфоксафлор, триаратен і триазамат і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки за даним винаходом можна комбінувати з гербіцидами, які сумісні із сполуками за даним винаходом в носії, вибраному для нанесення, і не є антагоністами активності сполук за даним винаходом, з утворенням їх пестицидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом можна застосовувати разом з одним або

5 декількома іншими гербіцидами для боротьби з ширшою множиною небажаних рослин. При використанні разом з іншими гербіцидами заявлені сполуки за даним винаходом можна виготовляти з іншим гербіцидом(ами), змішувати в резервуарі з іншим гербіцидом(ами) або застосовувати послідовно з іншим гербіцидом(ами). Типові гербіциди включають, але не обмежуються ними: амідні гербіциди, такі як алідохлор, бефлубутамід, бензадокс, бензипрам,

10 бромбутид, кафенстрол, CDEA, ципразол, диметенамід, диметенамід-Р, дифенамід, епроназ, етніпромід, фентразамід, флупоксам, фомесафен, галосафен, ізокарбамід, ізоксабен, напропамід, нафталам, петоксамід, пропізамід, квінонамід і тебутам; анілідні гербіциди, такі як хлоранокрил, цисанлід, кломепроп, ципромід, дифлуфенікан, етобензанід, фенасулам, флуфенацет, флуфенікан, мефенацет, мефлуїдид, метаміфоп, моналід, напроанлід,

15 пентанохлор, піколінафен і пропаніл; арилаланінові гербіциди, такі як бензоілпроп, флампроп і флампроп-М; хлорацетанлідні гербіциди, такі як ацетохлор, алахлор, бутахлор, бутенахлор, делахлор, діетатил, диметахлор, метазахлор, метолахлор, S-метолахлор, претилахлор, пропахлор, прописохлор, принахлор, тербухлор, тенілхлор і ксилахлор; сульфоналідні гербіциди, такі як бензофлуор, перфлуїдон, пірмісульфан і профлуазол; сульфонамідні

20 гербіциди, такі як асулам, карбасулам, фенасулам і оризалін; тіоамідні гербіциди, такі як хлортіамід; антибіотичні гербіциди, такі як біланафос; гербіциди на основі бензойної кислоти, такі як хлорамбен, дикамба, 2,3,6-TBA і трикамба; гербіциди на основі піримідинілоксибензойної кислоти, такі як біспірибак і пірмінобак; гербіциди на основі піримідинілітіобензойної кислоти, такі як піритіобак; гербіциди на основі фталевої кислоти, такі як хлортал; гербіциди на основі

25 піколінової кислоти, такі як амінопіралід, клопіралід і піклорам; гербіциди на основі хінолінкарбонової кислоти, такі як квінклорак і квінмерак; миш'якові гербіциди, такі як какоділова кислота, CMA, DSMA, гексафлуорат, MAA, MAMA, MSMA, арсеніт калію і арсеніт натрію; бензоїлциклогександіононі гербіциди, такі як мезотрион, сулькотрион, тефурилтрион і темботрион; бензофуранілалкілсульфонатні гербіциди, такі як бенфуресат і етофумесат;

30 бензотіазольні гербіциди, такі як бензазолін; карбаматні гербіциди, такі як асулам, карбоксазол, хлорпрокарб, дихлормат, фенасулам, карбутилат і тербукарб; карбанилатні гербіциди, такі як барбан, BCPC, карбасулам, карбетамід, CEPC, хлорбуфам, хлорпрофам, CPPC, десмедифам, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, профам і свем; гербіциди на основі циклогексенових оксимів, такі як алоксидим, бутроксидим, клетодим, клопроксидим,

35 циклоксидим, профоксидим, сетоксидим, тепралоксидим і тралоксидим; циклопропілоксасольні гербіциди, такі як ізоксахлортол і ізоксафлутол; дикарбоксимідні гербіциди, такі як цинідон-етил, флумезин, флуміклорак, флуміюксазин і флуміпропіл; динітроанілінові гербіциди, такі як бенфлуралін, бутралін, динітрамін, еталфлуралін,

40 флухлоралін, ізопропалін, металпропалін, нітралін, оризалін, пендиметалін, продіамін, профлуралін і трифлуралін; динітрофенольні гербіциди, такі як динофенат, динопроп, диносам, диносеб, динотерб, DNOC, етиофен і мединотерб; гербіциди на основі дифенілового ефіру, такі як етоксифен; гербіциди на основі нітрофенілового ефіру, такі як ацифлуорфен, аклоніфен, біфенокс, хлометоксифен, хлорнітрофен, етніпромід, флуородифен, флуороглікофен, флуоронітрофен, фомесафен, фурилоксифен, галосафен, лактофен, нітрофен, нітрофлуорфен

45 і оксифлуорфен; дитіокарбаматні гербіциди, такі як дазомет і метам; галогеновані аліфатичні гербіциди, такі як алорак, хлорпон, далапон, флупропанат, гексахлорацетон, йодметан, метилбромід, монохлороцтова кислота, SMA і TCA; імідазолінонові гербіциди, такі як імазаметабенз, імазамокс, імазапик, імазапир, імазаквін і імазетапир; неорганічні гербіциди, такі як сульфамат амонію, боракс, хлорат кальцію, сульфат міді, сульфат заліза, азид калію, ціанат

50 калію, азид натрію, хлорат натрію і сірчана кислота; нітрильні гербіциди, такі як бромбоніл, бромксиніл, хлорксиніл, дихлобеніл, йодбоніл, іоксиніл і піраклоніл; фосфорорганічні гербіциди, такі як аміпрофос-метил, анілофос, бенсулід, біланафос, бутаміфос, 2,4-DEP, DMPA, ЕВЕР, фосамін, глуфосинат, глуфосинат-Р, гліфосат і іперофос; феноксигербіциди, такі як бромфеноксим, кломепроп, 2,4-DEB, 2,4-DEP, дифенопентен, дисул, ербон, етніпромід,

55 фентеракол і трифопсим; оксадіазолінові гербіциди, такі як метазол, оксадіаргіл, оксадіазон; оксасольні гербіциди, такі як феноксасульфон; гербіциди на основі феноксіоцтової кислоти, такі як 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-тіоетил і 2,4,5-T; гербіциди на основі феноксимасляної кислоти, такі як 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB і 2,4,5-TB; гербіциди на основі феноксипропіонової кислоти, такі як клопроп, 4-CPD, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, 3,4-DP, фенопроп, мекопроп і

60 мекопроп-Р; гербіциди на основі арилоксифеноксипропіонової кислоти, такі як хлоразифоп,

клодинафоп, клофоп, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, феноксапроп-Р, фентіапроп, флуазифоп, флуазифоп-Р, галоксифоп, галоксифоп-Р, ізоксапірифоп, метаміфоп, пропаквізафоп, квізалофоп, квізалофоп-Р і трифоп; фенілендіамінові гербіциди, такі як динітрамін і продіамін; піразольні гербіциди, такі як піроксасульфоп; бензоїлпіразольні гербіциди, такі як бензофенап, пірасульфотол, піразолінат, піразоксифен і топрамезон; фенілпіразольні гербіциди, такі як флуазолат, нипіраклофен, піоксаден і пірафлуфен; піридазинові гербіциди, такі як кредазин, піридафол і піридат; піридазинонові гербіциди, такі як бромпіразон, хлоридазон, димідазон, флуфенпір, метфлуразон, норфлуразон, оксапіразон і піданон; піридинові гербіциди, такі як амінопіралід, кліодинам, клопіралід, дитіопір, флуороксипір, галоксидин, піклорам, піколінафен, піриклор, тіазопір і триклопір; піримідиндіамінові гербіциди, такі як іпримідам і тіоклорим; четвертинні амонієві гербіциди, такі як циперкват, діетамкват, дифензокват, дикват, морфамкват і паракват; тіокарбаматні гербіциди, такі як бутилат, циклоат, діалат, ЕРТС, еспрокарб, етіолат, ізополінат, метіобенкарб, молінат, орбенкарб, пебулат, просульфоккарб, пірибутикарб, сульфалат, тіобенкарб, тіокарбазил, триалат і вернолат; тіокарбонатні гербіциди, такі як димексано, EXD і проксан; гербіциди на основі тіосечовини, такі як метиурон; триазинові гербіциди, такі як дипропетрин, індазифлам, триазифлам і тригідрокситриазин; хлортриазинові гербіциди, такі як атразин, хлоразин, ціаназин, ципразин, егліназин, іпазин, мезопразин, проціазин, прогліназин, пропазин, себутилазин, симазин, тербутилазин і триетазин; метокситриазинові гербіциди, такі як атратон, метометон, прометон, секбуметон, симетон і тербуметон; метилтіотриазинові гербіциди, такі як аметрин, азіпротрин, ціанатрин, десметрин, диметаметрин, метопротрин, прометрин, симетрин і тербутрин; триазинонові гербіциди, такі як аметридіон, амібозин, гексазинові, ізометіозин, метамітрон і метрибузин; триазольні гербіциди, такі як амітрол, кафенстрол, епроназ і флупоксам; триазолонові гербіциди, такі як амікарбазон, бенкарбазон, карфентразон, флукарбазон, іпфенкарбазон, пропоксикарбазон, сульфентразон і тіенкарбазон-метил; триазолопіримідинові гербіциди, такі як клорансулам, диклосулам, флорасулам, флуметсулам, метосулам, пеносулам і піроксулам; урацильні гербіциди, такі як бензфендизон, бромацил, бутафенацил, флупропацил, ізоцил, ленацил, сафлуфенацил і тербацил; гербіциди на основі сечовини, такі як бензтіазурон, кумілурун, циклурун, дихлоралсечовина, дифлуфензопір, ізонорурон, ізоурон, метабензтіазурон, монізоурон і норурон; гербіциди на основі фенілсечовини, такі як анізурун, бутурун, хлорбромурон, хлоретурон, хлортолурун, хлороксурон, даімурун, дифеноксурон, димефурон, діурон, фенурун, флуометурон, флуотіурон, ізопротурон, лінурун, метиурон, метилдимурон, метобензурун, метобромурон, метоксурон, монолінурун, монурон, небурон, парафлурун, фенобензурун, сидурон, тетрафлурун і тидіазурон; гербіциди на основі піримідинілсульфонілсечовини, такі як амідосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон, хлоримурон, циклосульфамурон, етоксисульфурон, флазасульфурон, флуцетосульфурон, флупірсульфурон, форамсульфурон, галосульфурон, імазосульфурон, мезосульфурон, метазосульфурон, нікосульфурон, ортосульфамурон, оксасульфурон, приміосульфурон, пропірсульфурон, піразосульфурон, римсульфурон, сульфометурон, сульфосульфурон і трифлорисульфурон; гербіциди на основі триазинілсульфонілсечовини, такі як хлорсульфурон, циносульфурон, етаметсульфурон, йодсульфурон, метсульфурон, просульфурон, тифенсульфурон, триасульфурон, трибенурун, трифлусульфурон і тритосульфурон; гербіциди на основі тіадіазолілсечовини, такі як бутіурун, етидимурон, тебутіурун, тіазафлурун і тидіазурон; і некласифікафоні гербіциди, такі як акролеїн, аліловий спирт, аміноциклопірахлор, азафенідин, бентазон, бензобіциклон, біциклопірон, бутідазол, ціанамід кальцію, камбендихлор, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, цинметилін, кломазон, СРМФ, крезол, ціанамід, орто-дихлорбензол, димепіперат, ендотал, флуоромідин, флуридон, флуорохлоридон, флуртамон, флутіацет, інданофан, метилізотіоціанат, ОСН, оксацикломефон, пентахлорфенол, пентоксазон, ацетат фенілртуті, просульфалін, пірибензоксим, пірифталід, квінокламін, родетаніл, сульглікапін, тидіазимін, тридифан, триметурун, трипропіндан і тритак.

Інший варіант здійснення даного винаходу стосується способу боротьби з ураженням грибами або його попередження. Цей спосіб включає нанесення на ґрунт, рослину, коріння, листя або вогнище гриба, або на область, в якій мають намір попередити зараження (наприклад, нанесення на злакові рослини), фунгіцидно ефективною кількістю однієї або декількох сполук формули I. Сполуки придатні для обробки різних рослин на фунгіцидних рівнях, одночасно виявляючи низьку фітотоксичність. Сполуки можуть бути придатні і як захисний засіб і/або як ерадикант.

Було виявлено, що сполуки мають значний фунгіцидний ефект, зокрема, для застосування в сільському господарстві. Багато сполук є особливо ефективними для застосування з

сільськогосподарськими культурами і садівничими рослинами. Додаткові переваги можуть включати, але не обмежуватися ними, поліпшення здоров'я рослини; збільшення виходу рослини (наприклад, збільшення біомаси і/або збільшення вмісту цінних інгредієнтів); поліпшення потужності рослин (наприклад, поліпшення росту рослин і/або зеленіше листя);

5 поліпшення якості рослини (наприклад, збільшення вмісту або поліпшення складу певних інгредієнтів); і збільшення толерантності рослини до абіотичного і/або біотичного стресу.

Фахівцям в даній галузі буде зрозуміло, що ефективність сполуки відносно вказаних вище грибів визначає загальну застосовність сполук як фунгіцидів. Сполуки мають широкі діапазони активності проти патогенів-грибів. Ілюстративні патогени можуть включати, але не

10 обмежуватися ними, крапчастість листя пшениці (*Septoria tritici*, також відомі як *Mycosphaerella graminicola*), паршу яблуні (*Venturia inaequalis*) і церкоспорну крапчастість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і інших культур і чорну "сигаток" бананів (*Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість активного матеріалу, що застосовується залежить не тільки від конкретного застосовуваного

15 активного матеріалу, але також від конкретної бажаної дії, виду грибів, з яким здійснюють боротьбу, і його стадії росту, а також частини рослини або іншого продукту, що підлягає контакту із сполуками. Таким чином, всі сполуки і складі, що їх містять, можуть бути не в рівній мірі ефективними в схожих концентраціях або проти одного і того ж виду грибів.

Сполуки ефективні при застосуванні з рослинами в інгібуючому захворюванні або

20 фітологічно прийнятній кількості. Термін "інгібуюча захворювання і фітологічно прийнятна кількість" стосується кількості сполуки, яка знищує або інгібує захворювання рослини, боротьба з яким є бажаною, але не є значною мірою токсичним для рослини. Ця кількість, як правило, складає від приблизно 0,1 до приблизно 1000 ч/млн (частин на мільйон), причому переважними є від 1 до 500 ч/млн. Точна необхідна кількість сполуки варіює залежно від захворювання, що

25 викликається грибом, з яким здійснюють боротьбу, використовуюваного типу складу, способу застосування і конкретного виду рослини, умов клімату і т. п. Придатний рівень нанесення, як правило, знаходиться в діапазоні від приблизно 0,10 до приблизно 4 фунтів/акр (приблизно від 0,01 до 0,45 грам на квадратний метр, г/м²).

Будь-який діапазон або бажана величина, приведений в даному документі, можуть бути розширені або змінені без втрати шуканих ефектів, як очевидно кваліфікованому фахівцеві, для розуміння вказівок, представлених в даному документі.

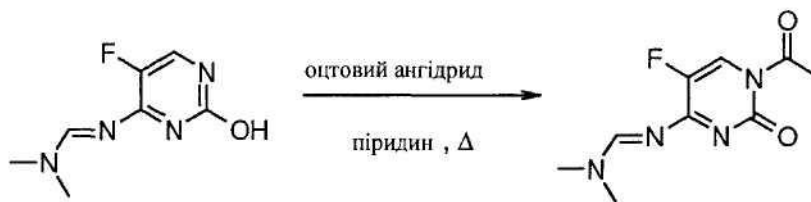
Сполуку формули I можна отримувати з використанням добре відомих хімічних способів. Проміжні сполуки, не згадані конкретно в цьому описі, є або комерційно доступними, або їх можна легко синтезувати з комерційних вихідних матеріалів з використанням стандартних

35 способів.

Наступні приклади надані для ілюстрації різних аспектів сполук за даним винаходом, і їх не треба тлумачити як обмеження формули винаходу.

Приклад 1: отримання N'-(1-ацетил-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-N, N-диметилформамідину (1)

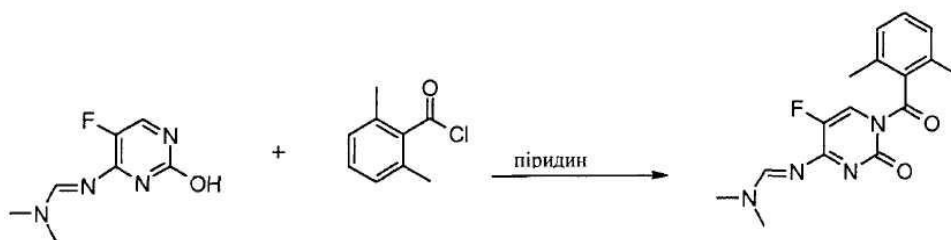
40



N'-(5-Фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідин (70 міліграм (мг), 38 мілімоль (ммоль)) суспендували в піридині (1 мілілітр (мл)) і додавали оцтову ангідрид (3 краплі, надлишок). Реакційну ємність струшували і короткочасно нагрівали струменевою повітряною сушаркою до отримання прозорого розчину. При охолодженні реакційний розчин залишався прозорим, і аналіз за допомогою недефективної рідинної хроматографії (UPLC) показав 100% перетворення в речовину з молекулярною масою (ММ) бажаного продукту. Упарювання дало твердий залишок, який струшували з невеликою кількістю діетилового ефіру (Et₂O) і гептану і фільтрували з отриманням вказаної в заголовку сполуки у вигляді білої твердої речовини (57

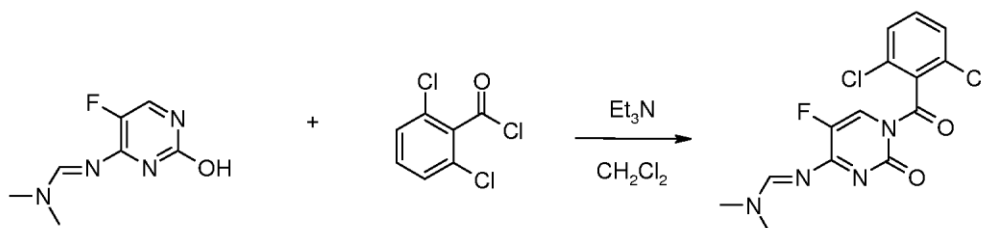
50 мг, 65%): mp 125-130°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,88 (с, 1H), 8,19 (д, 1H), 3,29 (шир. с, 6H), 2,81 (с, 3H); ESIMS m/z 227 ([M+H]⁺).

Приклад 2: Отримання N'-[1-(2,6-диметилбензоїл)-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]-N, N-диметилформамідину (2)



У 8-мл флакон із закрученою кришкою додавали піридин (2 мл), N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідин (100 мг, 0,54 ммоль) і 2,6-диметилбензоїлхлорид (102 мг, 0,60 ммоль). Суміш нагрівали до 40°C протягом 2 год, упарювали до сухого стану і розподіляли між етилацетатом (EtOAc) і водою (H₂O). Органічну фазу сушили над сульфатом магнію (MgSO₄), фільтрували, упарювали, і залишок очищали обернено-фазовою хроматографією з отриманням вказаної в заголовку сполуки у вигляді білої твердої речовини (63 мг, 37%): mp 120-150°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,81 (с, 1H), 8,22 (д, J=6,04 Гц, 1H), 7,23-7,17 (м, 1H), 7,07-7,01 (м, 2H), 3,27 (с, 3H), 3,24 (с, 3H), 2,24 (с, 6H); ESIMS m/z 317 ([M+H]⁺).

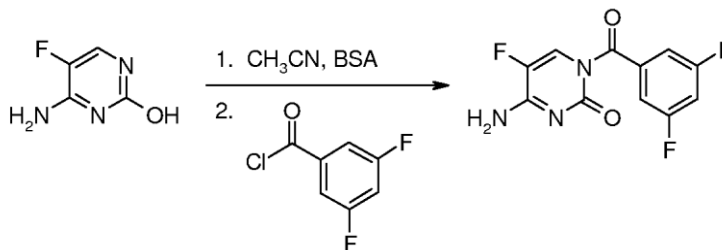
Приклад 3: Отримання N'-[1-(2,6-дихлорбензоїл)-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]-N,N-диметилформамідину (3)



У 8-мл флакон із закрученою кришкою додавали дихлорметан (CH₂Cl₂; 4 мл), N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідин (100 мг, 0,54 ммоль) і триетиламін (Et₃N; 120 мг, 1,2 ммоль). До цієї суміші додавали 2,6-дихлорбензоїлхлорид (113 мг, 0,54 ммоль), і отриману суміш струхували при кімнатній температурі протягом 24 год. Після упарювання до сухого стану залишок відбирали в N,N-диметилформаміді (DMF; 2 мл), фільтрували і вміщували безпосередньо в колонку для обернено-фазової хроматографії. Після елюювання виділяли вказану в заголовку сполуки у вигляді ясно-жовтої твердої речовини (75 мг, 39%): mp 185-187°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,80 (с, 1H), 8,20 (д, J=5,6 Гц, 1H), 7,31-7,20 (м, 3H), 3,23 (с, 3H), 3,21 (с, 3H); ESIMS m/z 357 ([M+H]⁺).

Сполуки 4-12 в таблиці I отримували згідно з прикладом 3.

Приклад 4: Отримання 4-аміно-1-(3,5-дифторбензоїл)-5-фтор-1H-піримідин-2-ону (13)



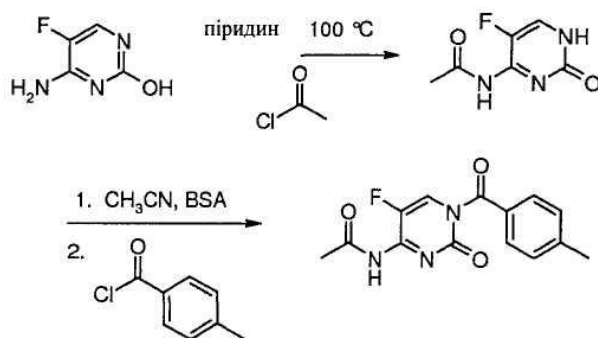
У 8-мл флакон із закрученою кришкою, що містить 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол* (100 мг, 0,775 ммоль) і ацетонітрил (CH₃CN; 3 мл), додавали біс-N, O-триметилсилілацетамід (BSA; 378 мікролітрів (мкл), 1,55 ммоль). Суміш нагрівали до 70°C протягом 1 год з отриманням прозорого розчину. Після охолодження до кімнатної температури додавали 3,5-дифторбензоїлхлорид (182 мкл, 1,55 ммоль), і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 12 год. Утворювався білий осад і його збирали вакуумною фільтрацією. Тверду речовину промивали Et₂O (1×10 мл) і сушили повітрям протягом ночі з отриманням кінцевого

продукту у вигляді білої твердої речовини (126 мг, 60%): m_p 227-231°C; 1H ЯМР (300 МГц, $DMCO-d_6$) δ 8,54 (шир. с, 1H), 8,27 (шир. с, 1H), 8,14 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 7,80-7,35 (м, 3H); ESIMS m/z 270 (M+H), 268 (M-H).

*4-аміно-5-фтор-піримідин-2-ол можна придбавати комерційно.

5 Сполуки 14-20 в таблиці I отримували згідно з прикладом 4.

Приклад 5: Отримання N-(5-фтор-1-(4-метилбензоїл)-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)ацетаміду (21)



10

А) В круглодонну колбу при кімнатній температурі додавали 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол* (5,0 г, 38,7 ммоль) і сухий піридин (25 мл), а потім ацетилхлорид (3,35 мл, 42,6 ммоль). Суміш нагрівали до 100°C протягом 90 хв, забезпечуючи розчинення твердої речовини. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури (і в даний час тверда речовина може випадати в осад з розчину). Тверду речовину відфільтровувати і промивали послідовно невеликими кількостями етилового спирту (EtOH), крижаної води і метил-трет-бутилового ефіру (MTBE, 50 мл) з отриманням білого твердого матеріалу. Неочищену тверду речовину перекристалізовували з EtOH і сушили при кімнатній температурі у вакуумній печі протягом 2 год з отриманням білої твердої речовини (4,3 г, 65%).

15

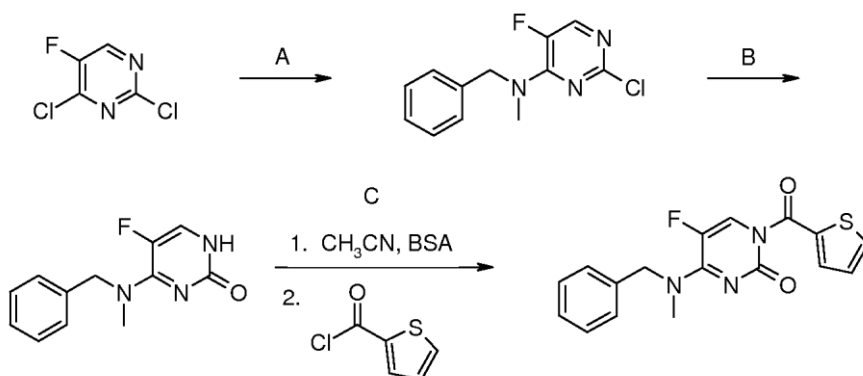
20 *4-аміно-5-фтор-піримідин-2-ол можна придбавати комерційно.

В) В круглодонну колбу, що містить N-(5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)ацетамід (350 мг, 2,04 ммоль) в CH_2Cl_2 (20 мл), додавали 4-метилбензоїлхлорид (316 мг, 2,2 ммоль) і Et_3N (454 мг, 4,5 ммоль) при 0°C. Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 год. Реакційну суміш розбавляли CH_2Cl_2 (30 мл), промивали насиченим водним розчином хлориду натрію (насич. водн. NaCl) (1(15 мл), сушили над Na_2SO_4 і концентрували у вакуумі. Неочищену тверду речовину очищали обернено-фазовою хроматографією з отриманням N-(5-фтор-1-(4-метилбензоїл)-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)ацетаміду у вигляді білої твердої речовини (16 мг, 3%): m_p 146,9-148,2°C; 1H ЯМР (ацетон- d_6) δ 9,75 (с, 1H), 8,64 (д, $J=2,5$ Гц, 1H), 8,06 (д, $J=8,2$ Гц, 2H), 7,44 (д, $J=8,1$ Гц, 2H), 2,47 (с, 3H), 2,32 (с, 3H).

25

30 Сполуки 22-24 в таблиці I отримували згідно з прикладом 5.

Приклад 6: Отримання 4-(бензил(метил)аміно)-5-фтор-1-(тіофен-2-карбоніл)піримідин-2(1H)-ону (25)



35

А) До суспензії 2,4-дихлор-5-фторпіримідину (0,30 г, 1,80 ммоль) в діоксані (3,6 мл) додавали N-етил-N-ізопропілпропан-2-амін (0,23 г, 1,80 ммоль) і N-метил-1-фенілметанамін

(0,24 г, 1,98 ммоль), і отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 16 год. Реакційну суміш розбавляли EtOAc (15 мл), і отриманий розчин промивали H₂O (2×5 мл). Органічну фазу сушили над Na₂SO₄, фільтрували і концентрували до ясно-жовтого масла, яке очищали нормально-фазовою хроматографією (40 г SiO₂; градієнт: EtOAc/гексан) з отриманням безбарвного масла, яке застигало при охолодженні. Тверду речовину сушили у високому вакуумі при 23°C протягом 16 год з отриманням N-бензил-2-хлор-5-фтор-N-метилпіримідин-4-аміну (0,34 г, 76%) у вигляді білої твердої речовини: mp 47-49°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,18 (д, J=6,4, 1H), 7,43-7,23 (м, 5H), 4,82 (с, 2H), 3,17 (д, J=3,3, 3H); EIMS m/z 251 (M)⁺.

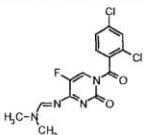
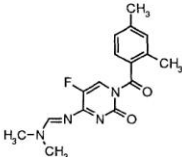
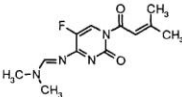
В) До суспензії N-бензил-2-хлор-5-фтор-N-метилпіримідин-4-аміну (7,5 г, 27,1 ммоль) в суміші діоксан/H₂O (1:1, загальний об'єм 186 мл) додавали гідроксид калію (KOH; 1,7 г, 27,1 ммоль). Суміш нагрівали до 100°C і перемішували протягом 72 год. Реакційну суміш розбавляли H₂O (50 мл), і pH доводили до 7 за допомогою 2 Н HCl. Отриманий білий осад збирали вакуумною фільтрацією, але більша частина продукту залишалася у водній фазі. Тверду речовину і фільтрат об'єднували, і розчинник видаляли азеотропною перегонкою з CH₃CN у вакуумі. Залишок розчиняли/суспендували в CH₂Cl₂ (25 мл), адсорбували на целіт (3,0 г) і очищали флеш-хроматографією (24 г SiO₂; градієнт: MeOH/CH₂Cl₂) з отриманням 4-(бензилметиламіно)-5-фторпіримідин-2-олу (4,4 г, 45%) у вигляді білої твердої речовини: mp 122,8-123,6°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 12,72 (с, 1H), 7,42-7,14 (м, 6H), 4,88 (с, 2H), 3,20 (д, J=3,2 Гц, 3H); ESIMS m/z 235 (M+2)⁺, 232 (M-H)⁻.

С) В круглодонну колбу, в яку були вміщені 4-(бензил(метил)аміно)-5-фторпіримідин-2(1H)-он (250 мг, 1,06 ммоль) в CH₂Cl₂ (11 мл) і 2-тіофенкарбонілхлорид (172 мг, 1,1 ммоль, 1,1 екв.), додавали Et₃N (237 мг, 2,35 ммоль) при 0°C в атмосфері N₂. Після завершення додавання реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом 12 год. Реакційну суміш розбавляли CH₂Cl₂ (25 мл), промивали насич. водн. розчином NaCl (10 мл), сушили над Na₂SO₄ і упарювали до сухого стану у вакуумі при кімнатній температурі. Неочищений продукт очищали обернено-фазовою хроматографією з отриманням продукту у вигляді білої твердої речовини (23 мг, 6%): mp 101,3-102,4°C; ¹H ЯМР (метанол-d₄) δ 8,10 (д, J=6,3 Гц, 1H), 8,00 (д, J=3,8 Гц, 1H), 7,91 (д, J=4,9 Гц, 1H), 7,38-7,20 (м, 6H), 4,88 (с, 2H), 3,22 (д, J=3,2 Гц, 3H); ESIMS m/z 344 ([M+H]⁺).

Сполуки 26 і 27 в таблиці I отримували згідно з прикладом 6.

Таблиця I

Сполуки і характеризуючі їх дані

Сполука	Структура	МС	Т. пл. (°C)	Зовнішній вигляд	¹ H ЯМР ² (δ, розчинник)
4		ESIMS ⁺ 357		прозоре безбарвне масло	(CDCl ₃) 8,85 (с, 1H), 8,04 (д, J=5,06 Гц, 1H), 7,43-7,30 (м, 3H), 3,26 (с, 3H), 3,25 (с, 3H)
5		ESIMS ⁺ 317		біла клейка тверда речовина	(CDCl ₃) 8,80 (с, 1H), 7,90 (д, J=5,9 Гц, 1H), 7,29 (д, J=7,9 Гц, 1H), 7,04 (с, 1H), 6,97 (д, J=7,9 Гц, 1H), 3,21 (с, 3H), 3,19 (с, 3H), 2,42 (с, 3H), 2,31 (с, 3H)
6		ESIMS 289 (M+Na)	128-130		(CDCl ₃) 8,85 (с, 1H), 8,03 (д, J=6,3 Гц, 1H), 6,85 (шир.с, 1H), 3,24 (с, 3H), 3,23 (с, 3H), 2,21 (с, 3H), 2,02 (с, 3H)

7		ESIMS m/z 289 ($[M+H]^+$)	137,3-139,2	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,68 (с, 1H), 8,44 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,11 (дд, $J=8,3$, 1,2 Гц, 2H), 7,83-7,75 (м, 1H), 7,63 (т, $J=7,8$ Гц, 2H), 3,20 (с, 3H), 3,11 (с, 3H)
8		ESIMS m/z 319 ($[M+H]^+$)	126,2-128,3	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,67 (с, 1H), 8,42 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,09-8,03 (м, 2H), 7,19-7,09 (м, 2H), 3,88 (с, 3H), 3,20 (с, 3H), 3,11 (с, 3H)
9		ESIMS m/z 303 ($[M+H]^+$)	128,8-130,5	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,67 (с, 1H), 8,43 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 7,99 (д, $J=8,2$ Гц, 2H), 7,43 (д, $J=8,3$ Гц, 2H), 3,19 (с, 3H), 3,11 (с, 3H), 2,43 (с, 3H)
10		ESIMS m/z 295 ($[M+H]^+$)	154,8-156,5	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,68 (с, 1H), 8,43 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,14 (дд, $J=4,9$, 1,2 Гц, 1H), 8,03 (дд, $J=3,8$, 1,3 Гц, 1H), 7,33 (дд, $J=4,9$, 3,8 Гц, 1H), 3,21 (с, 3H), 3,11 (с, 3H)
11		ESIMS m/z 325 ($[M+H]^+$)	130-132	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,67 (с, 1H), 8,45 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,18-8,09 (м, 1H), 8,05-7,96 (м, 1H), 7,77-7,65 (м, 1H), 3,20 (с, 3H), 3,11 (с, 3H)
12		ESIMS m/z 323 ($[M+H]^+$)	95,3-97,7	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,71 (с, 1H), 8,48 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,10 (дд, $J=4,4$, 2,6 Гц, 2H), 7,94-7,86 (м, 1H), 7,68 (дд, $J=26,4$, 18,3 Гц, 1H), 3,23 (с, 3H), 3,14 (с, 3H)
14		ESIMS m/z 234 ($[M+H]^+$), 232 ($[M-H]^+$)	213,2-215,3	біла тверда речовина	(метанол- d_4) 8,04-7,97 (м, 2H), 7,90 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 7,64-7,52 (м, 1H), 7,51-7,40 (м, 2H)
15		ESIMS m/z 262 ($[M-H]^+$)	257,9-259,6	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,28 (с, 1H), 8,08 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 8,03 (с, 1H), 7,74 (д, $J=8,8$ Гц, 2H), 7,03 (д, $J=8,8$ Гц, 2H), 3,85 (с, 3H)
16		ESIMS m/z 252 ($[M+H]^+$), 250 ($[M-H]^+$)	228,3-229,7	біла тверда речовина	(метанол- d_4) 7,90 (д, $J=5,0$ Гц, 1H), 7,80 (м, $J=6,8$ Гц, 1H), 7,67 (д, $J=5,7$ Гц, 1H), 7,60-7,49 (м, 1H), 7,34-7,04 (м, 3H)
17		ESIMS m/z 248 ($[M+H]^+$), 246 ($[M-H]^+$)	257-259,5	біла тверда речовина	(DMCO- d_6) 8,34 (с, 1H), 8,19-8,01 (м, 2H), 7,64 (д, $J=8,0$ Гц, 2H), 7,30 (д, $J=7,8$ Гц, 2H), 2,38 (с, 3H)

18		ESIMS m/z 294 ([M+H] ⁺), 292 ([M-H] ⁻)	170-172	біла тверда речовина	(DMCO-d ₆) 8,35 (с, 1H), 8,16 (с, 1H), 8,11 (д, J=6,6 Гц, 1H), 7,39 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,32 (с, 1H), 7,05 (д, J=8,5 Гц, 1H), 3,86 (с, 3H), 3,80 (с, 3H)
19		ESIMS m/z 240 ([M+H] ⁺), 238 ([M-H] ⁻)	223,1-225,2	біла тверда речовина	(DMCO-d ₆) 8,39 (д, J=2,9, 1,3 Гц, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,08 (д, J=6,7 Гц, 2H), 7,60 (д, J=5,1, 3,0 Гц, 1H), 7,42- 7,35 (м, 1H)
20		ESIMS m/z 270 ([M+H] ⁺), 268 ([M-H] ⁻)	150-152	біла тверда речовина	(DMCO-d ₆) 8,48 (с, 1H), 8,22 (с, 1H), 8,12 (д, J=6,8 Гц, 1H), 7,87 (д, J=10,9, 7,7, 2,1 Гц, 1H), 7,66-7,51 (м, 2H)
22		ESIMS m/z 276 ([M+H] ⁺), 274 ([M-H] ⁻)	122,8-123,6	біла тверда речовина	(CDCl ₃) 8,43 (д, J=1,9 Гц, 1H), 8,20 (д, J=8,4, 1,3 Гц, 2H), 7,79 (с, 1H), 7,67 (д, J=10,5, 4,4 Гц, 1H), 7,53 (д, J=9,8, 5,8 Гц, 2H), 2,57 (с, 3H)
23		ESIMS m/z 310 ([M+H] ⁺)	129,5-131	не зовсім біла тверда речовина	(ацетон-d ₆) 9,78 (с, 1H), 8,65 (д, J=2,5 Гц, 1H), 8,20- 8,07 (м, 1H), 7,89-7,79 (м, 1H), 7,70-7,64 (м, 1H), 7,58- 7,44 (м, 1H), 2,32 (с, 3H)
24		ESIMS m/z 282 ([M+H] ⁺)		жовта камедь	(ацетон-d ₆) 9,78 (с, 1H), 8,64 (д, J=2,5 Гц, 1H), 8,09- 8,02 (м, 2H), 7,37-7,30 (м, 1H), 2,32 (с, 3H)
26		ESIMS m/z 374 ([M+H] ⁺)		коричнева рідина	(ацетон-d ₆) 8,16 (д, J=6,1 Гц, 1H), 8,08-8,01 (м, 2H), 7,58 (д, J=9,9, 7,9 Гц, 1H), 7,40-7,32 (м, 5H), 4,91 (с, 2H), 3,24 (д, J=3,4 Гц, 3H)
27		ESIMS m/z 368 ([M+H] ⁺)		рідина	(ацетон-d ₆) 8,14 (д, J=6,2 Гц, 1H), 8,12-8,08 (м, 2H), 7,38-7,34 (м, 5H), 7,13-7,09 (м, 2H), 4,91 (с, 2H), 3,94 (с, 3H), 2,83 (с, 3H)

Приклад 5: Оцінка фунгіцидної активності: плямистість листя пшениці (*Mycosphaerella* *graminicola*; анаморф: *Septoria tritici*; код Bayer: SEPTTR)

Рослини пшениці (сорт Yuma) вирощували з насіння в теплиці в 50% мінеральному ґрунті/50% суміші Metro без ґрунту доти, доки перший лист не з'являвся повністю, в кількості 7-10 проростків на горщик. Ці рослини інокулювали водною суспензією спор *Septoria tritici* або до, або після обробок фунгіцидом. Після інокуляції рослини тримали при відносній вологості 100% (одна доба в темній зрошуваній камері на від двох до трьох діб в освітленій зрошуваній камері) для забезпечення проростання спор і інфікування листя. Потім рослини переносили в теплицю для розвитку захворювання.

У таблиці нижче представлена активність типових сполук за даним винаходом, коли їх оцінювали в цих експериментах. Ефективність тестованих сполук відносно боротьби із захворюванням визначали шляхом оцінки тяжкості захворювання на оброблених рослинах, потім конвертування тяжкості захворювання в процент боротьби із захворюванням, виходячи з рівня захворювання на необроблених інокульованих рослинах.

У кожному випадку в таблиці II показник оцінки є наступним:

% боротьби із захворюванням	Оцінка
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
не протестовано	E

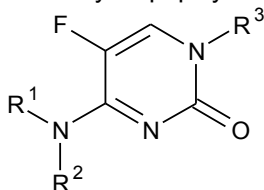
ТАБЛИЦЯ II

Захисна активність протягом однієї доби (IDP) і активність лікування протягом трьох діб (3DC) для сполук відносно SEPTTR в кількості 100 ч/млн

Сполука	SEPTTR 100 ч/млн 1DP	SEPTTR 100 ч/млн 3DC
1	A	A
2	A	A
3	B	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	E	E
13	A	A
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A
21	E	E
22	E	E
23	E	E
24	E	E
25	E	E
26	E	E
27	E	E

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука формули I:



Формула I

де R¹ являє собою:

H;

- 10 C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;
 C₁-C₆алкеніл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;
 C₃-C₆алкініл, необов'язково заміщений 1-3 R⁴;
 феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R⁵
 15 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою
 кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3
 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R⁵, біфенілом або
 нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R⁵;
 20 -(CHR⁶)_mOR⁷;
 -C(=O)R⁸;
 -C(=S)R⁸;

- $-C(=O)OR^8$;
 $-C(=S)OR^8$;
 $-(CHR^6)_mN(R^9)R^{10}$;
 $-C(=O)N(R^9)R^{10}$ або
5 $-C(=S)N(R^9)R^{10}$;
 $-C(=S)R^8$;
 $-C(=O)OR^8$;
 $-C(=S)OR^8$;
 $-S(O)_2R^8$;
10 $-(CHR^6)_mN(R^9)R^{10}$;
 $-C(=O)N(R^9)R^{10}$ або
 $-C(=S)N(R^9)R^{10}$;
де m являє собою ціле число, що дорівнює 1-3;
 R^2 являє собою:
15 H або
 C_1 - C_6 алкіл, необов'язково заміщений R^4 ;
альтернативно R^1 і R^2 , взяті разом, можуть утворювати $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$;
 R^3 являє собою:
 $-C(=O)R^8$ або
20 $-C(=S)R^8$;
 R^4 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкілтіо, C_1 - C_4 галогеналкілтіо, аміно, галогентіо, C_1 - C_3 алкіламіно, C_2 - C_6 алкоксикарбоніл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, C_2 - C_6 алкіламінокарбоніл, гідроксил або C_3 - C_6 триалкілсиліл;
25 R^5 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, C_2 - C_6 алкоксикарбоніл або C_2 - C_6 алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;
 R^6 являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;
30 R^7 являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 ;
35 R^8 являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R^5 ;
40 R^9 являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або конденсованою кільцевою системою 5-6, або конденсованою кільцевою системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R^5 ;
45 R^{10} являє собою H , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, бензил, де бензил необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;
50 альтернативно R^9 і R^{10} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 ;
 R^{11} являє собою H або C_1 - C_4 алкіл;
 R^{12} являє собою H , ціано, гідроксил, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або
55 бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ;
альтернативно R^{11} і R^{12} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 ;
 R^{13} являє собою H , C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з
60 фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 R^5 ; і

альтернативно R^{12} і R^{13} , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членне насичене або ненасичене кільце, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце необов'язково може бути заміщене 1-3 R^5 .

5 2. Композиція для боротьби з патогеном-грибом, що містить сполуку за п. 1 і фітологічно прийнятний носій.

3. Композиція за п. 2, де патоген-гриб являє собою паршу яблунь (*Venturia inaequalis*), крапчастість листя пшениці (*Septoria tritici*), плямистість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і чорну "сигаток" бананів (*Mycosphaerella fijiensis*).

10 4. Спосіб боротьби або попередження ураження грибом на рослині, в якому здійснюють: нанесення фунгіцидно ефективною кількості щонайменше однієї зі сполук за п. 1 щонайменше на одне з: рослини, площі, сусідньої з рослиною, ґрунту, адаптованого для підтримання росту рослини, кореня рослини, листя рослини і насіння, адаптованого для виробництва рослини.

Комп'ютерна верстка В. Мацело

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