



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **106086** (13) **C2**  
(51) МПК (2014.01)  
**C07D 339/00**

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

<b>(21)</b> Номер заявки: <b>а 2012 02680</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и): <b>Бібель Тімоті (US),</b> <b>Брайан Крісті (US),</b> <b>Лорсбах Бет (US),</b> <b>Мартін Тімоті (US),</b> <b>Оуен В. (US),</b> <b>Побанс Марк (US),</b> <b>Торнберг Скотт (US),</b> <b>Вебстер Джеффри (US),</b> <b>Яо Ченьлінь (US)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки: <b>05.08.2010</b>	
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на винахід: <b>25.07.2014</b>	
<b>(31)</b> Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>61/232,232</b>	
<b>(32)</b> Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>07.08.2009</b>	
<b>(33)</b> Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: <b>US</b>	<b>(73)</b> Власник(и): <b>ДАУ АГРОСАЙЕНСІЗ ЕЛЕЛСІ,</b> 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054, United States of America (US)
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку: <b>10.04.2012, Бюл.№ 7</b>	<b>(74)</b> Представник: <b>Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115</b>
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту: <b>25.07.2014, Бюл.№ 14</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 97/33890, A1, 18.09.1997 US 3,368,938, A, 13.02.1968
<b>(86)</b> Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: <b>РСТ/US2010/044585, 05.08.2010</b>	

**(54) 5-ФТОР-2-ОКСОПІРИМІДИН-1(2Н)-КАРБОКСИЛАТНІ ПОХІДНІ**

**(57) Реферат:**

Даний винахід стосується області 5-фтор-2-оксопіримідин-1(2Н)-карбоксилатів та їх похідних і застосування цих сполук як фунгіцидів.

**UA 106086 C2**



Перехресне посилання на споріднені заявки

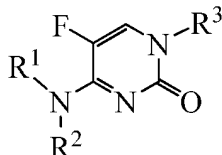
По даній заявці заявляється пріоритет згідно з попередньою заявкою на патент США під номером 61/232232, поданою 7 серпня 2009 року.

Передумови створення і короткий виклад суті винаходу

Фунгіциди являють собою сполуки, природного або синтетичного походження, які діють відносно захисту і/або лікування рослин, проти пошкодження, що викликається грибами, які належать до сільського господарства. Як правило, жоден фунгіцид не є придатним у всіх ситуаціях. Отже, дане дослідження проводилося для отримання фунгіцидів, які можуть мати кращу характеристику, є легше використовуваними і мають меншу вартість.

Даний винахід стосується 5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилатних похідних і їх застосування як фунгіцидів. Сполуки згідно з даним винаходом можуть надавати захист проти аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтероміцетів і ооміцетів.

Одне втілення даного винаходу може включати сполуки формули I:



де  $R^1$  означає:

H;

$C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений 1-3  $R^4$ ;

$C_1$ - $C_6$ -алкеніл, необов'язково заміщений 1-3  $R^4$ ;

$C_3$ - $C_6$ -алкініл, необов'язково заміщений 1-3  $R^4$ ;

феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ ; або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

$-(CHR^6)_mOR^7$ ;

$-C(=O)R^8$ ;

$-C(=S)R^8$ ;

$-S(O)_2R^8$ ;

$-C(=O)OR^8$ ;

$-C(=S)OR^8$ ;

$-(CHR^6)_mN(R^9)R^{10}$ ;

$-C(=O)N(R^9)R^{10}$ ; або

$-C(=S)N(R^9)R^{10}$ ;

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

$R^2$  означає H або  $C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений  $R^4$ ;

альтернативно,  $R^1$  і  $R^2$ , взяті разом, можуть утворювати  $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$ ;

$R^3$  означає  $-C(=O)OR^8$  або  $-C(=S)OR^8$ ;

$R^4$  незалежно означає 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,  $C_1$ - $C_4$ -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  $C_3$ - $C_6$ -тріалкілсиліл,

$R^5$  незалежно означає 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, 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, галогентіо;

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

$R^7$  означає 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 може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

$R^8$  означає 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,  $-(CH_2)_2OCH_2(C_6H_5)$ , феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути

необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>; або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R<sup>5</sup>;

5 R<sup>9</sup> означає H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкоксіалкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>; або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R<sup>5</sup>;

10 R<sup>10</sup> означає H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкоксіалкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкілкарбоніл, бензил, де бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

альтернативно, R<sup>9</sup> і R<sup>10</sup>, взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

15 R<sup>11</sup> означає H або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл;

R<sup>12</sup> означає H, ціано, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>; або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R<sup>5</sup>;

20 альтернативно, R<sup>11</sup> і R<sup>12</sup>, взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

R<sup>13</sup> означає H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>; або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R<sup>5</sup>; і

30 альтернативно, R<sup>12</sup> і R<sup>13</sup>, взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>.

Інше втілення даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для боротьби або запобігання грибовій атаці, що містить сполуки, описані нижче, і ботанічно прийнятний носій.

35 Ще одне втілення даного винаходу може включати спосіб боротьби або запобігання грибовій атаці відносно рослини, причому цей спосіб включає стадії нанесення фунгіцидно ефективною кількістю однієї або більше сполуки, описані нижче, щонайменше на один з грибків, на рослину, на площу, яка прилягає до рослини, і насіннєвий матеріал, адаптований для виробництва рослини.

Термін "алкіл" стосується розгалуженого, нерозгалуженого або циклічного вуглецевого ланцюга, що включає 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 більше подвійних зв'язків, що включає етеніл, пропеніл, бутеніл, ізопропеніл, ізобутеніл, циклогексеніл і т. п.

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

Як використовується протягом всьому даного опису, термін "R" стосується групи, яка складається з C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-алкілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-алкенілу або C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-алкінілу, якщо не вказане інше.

Термін "алкокси" стосується замісника -OR.

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

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

Термін "алкілсульфоніл" стосується замісника -SO<sub>2</sub>-R.

Термін "галогеналкілсульфоніл" стосується замісника -SO<sub>2</sub>-R, де R повністю або частково заміщений Cl, F, I або Br, або їх будь-якою комбінацією.

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

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

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

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

60 Термін "діалкіламінокарбоніл" стосується замісника -C(O)-NR<sub>2</sub>.

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

Термін "триалкілсиліл" стосується  $-\text{SiR}_3$ .

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

5 Термін "гідроксил" стосується замісника  $-\text{OH}$ .

Термін "аміно" стосується замісника  $-\text{NH}_2$ .

Термін "алкіламіно" стосується замісника  $-\text{N}(\text{H})-\text{R}$ .

Термін "діалкіламіно" стосується замісника  $-\text{NR}_2$ .

Термін "алкоксіалкіл" стосується алкоксизаміщення в алкілі.

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

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

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

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

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

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

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

Термін "гідроксикарбоніл" стосується замісника  $-\text{C}(\text{O})-\text{OH}$ .

Термін "нітро" стосується замісника  $-\text{NO}_2$ .

25 Протягом всьому опису посилання на сполуки формули I тлумачиться як також таке, що включає оптичні ізомери і солі сполуки формули I і її гідрати. Особливо, коли сполука формули I містить алкільну групу з розгалуженим ланцюгом, мають на увазі, що такі сполуки включають оптичні ізомери і їх рацемати. Приклади солей включають: гідрохлорид, гідробромід, гідройодид і т. п. Додатково, сполуки формули I можуть включати таутомерні форми.

30 Деякі сполуки, описані в даному документі, можуть існувати у вигляді одного або більше ізомері. Кваліфікованому фахівцеві в даній галузі повинне бути зрозуміло, що один ізомер може бути більш активним, ніж інші. Структури, розкриті в даному описі, представлені тільки в одній геометричній формі, для ясності, але мають на увазі наявність всіх геометричних і таутомерних форм молекули.

35 Кваліфікованому фахівцеві в даній галузі також повинно бути зрозумілим, що допускається додаткове заміщення, якщо не вказане інше, доти, поки це відповідає правилам хімічного зв'язування і енергії деформації і продукт ще виявляє фунгіцидну активність.

Інше втілення даного винаходу являє собою застосування сполуки формули I, для захисту рослини від атаки фітопатогенним організмом або лікування рослини, зараженої

40 фітопатогенним організмом, що включає нанесення сполуки формули I або композиції, яка містить сполуку, на ґрунт, рослину, частину рослини, листя і/або насіння.

Додатково, інше втілення даного винаходу являє собою композицію, придатну для захисту рослини від атаки фітопатогенним організмом і/або лікування рослини, зараженої

45 фітопатогенним організмом, що містить сполуку формули I і ботанічно прийнятний носій.

Додаткові особливості і переваги даного винаходу стануть очевидними кваліфікованому фахівцеві в даній галузі при розгляді наступного докладного опису ілюстративних втілень, що служать прикладом найкращого шляху здійснення даного винаходу, як тепер зрозуміло.

Докладний опис даного винаходу

Сполуки згідно з даним винаходом можна наносити будь-яким з множини відомих способів,

50 або у вигляді сполук або у вигляді композицій, що містять ці сполуки.

Наприклад, сполуки можна наносити на коріння, насіння або листя рослин для боротьби з різними грибками, без нанесення збитку комерційній цінності рослин. Речовини можна наносити в формі будь-якого зі звичайно використовуваних типів композицій, наприклад, у вигляді розчинів, дустів, змочуваних порошків, текучих концентратів або емульгованих концентратів.

55 Переважно, сполуки згідно з даним винаходом наносять в формі композиції, що містить одну або більше сполук формули I разом з ботанічно прийнятним носієм. Концентровані композиції можна диспергувати у воді або інших рідинах для нанесення, або композиції можуть бути подібними до дустів або гранульованими, які потім можна наносити без подальшої обробки. Композиції можуть бути отримані відповідно до методик, які є стандартними в

60 сільськогосподарській хімічній практиці.

Згідно з даним винаходом передбачаються всі носії, за допомогою яких одна або більше сполук можуть бути складені в готову форму для доставки і застосування як фунгіциду. Звичайно композиції наносять у вигляді водних суспензій або емульсій. Такі суспензії або емульсії можна отримувати з розчинних у воді, суспендованих у воді або емульгованих композицій, які є твердими, звичайно відомими як змочувані порошки; або рідин, звичайно відомих як емульговані концентрати, водні суспензії або суспендовані концентрати. Як буде легко оцінено, може бути використана будь-яка речовина, до якої ці сполуки можуть бути додані, якщо тільки вона дає бажану користь без істотної інтерференції з активністю цих сполук як протигрибкових агентів.

Змочувані порошки, які можуть бути щільно упакованими в формі диспергованих у воді гранул, містять однорідну суміш однієї або більше сполук формули I, інертного носія і поверхнево-активних речовин. Концентрація сполуки в змочуваному порошку може складати від приблизно 10 мас. % до приблизно 90 мас. %, з розрахунку на загальну масу змочуваного порошку, більш переважно, від приблизно 25 мас. % до приблизно 75 мас. %. При отриманні композицій у вигляді змочуваного порошку, сполуки можна компаундувати з будь-якою тонкоподрібненою твердою речовиною, такою як пірофіліт, тальк, крейда, гіпс, фулерова земля, бентоніт, атапульгіт, крохмаль, казеїн, клейковина, монтморилонітові глини, діатомові землі, очищені силікати або т. п. У разі таких операцій, тонкоподрібнений носій і поверхнево-активні речовини звичайно змішують із сполукою(ами) і розмелюють.

Емульговані концентрати сполук формули I можуть мати відповідну концентрацію, таку як від приблизно 10 мас. % до 50 мас. % сполуки, у прийнятній рідині, з розрахунку на загальну масу концентрату. Сполуки можуть бути розчинені в інертному носії, який є або змішуваним з водою розчинником або сумішшю незмішуваних з водою органічних розчинників і емульгаторів. Концентрати можуть бути розбавлені водою і маслом з утворенням розпалюваних сумішей в формі емульсій масло-в-воді. Придатні органічні розчинники включають ароматичні, особливо висококиплячі нафталінові і олефінові частини нафти, такі як важка ароматична нафта. Також можна використовувати інші органічні розчинники, наприклад, терпенові розчинники, включаючи похідні каніфолі, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон, і складні спирти, такі як 2-етоксіетанол.

Емульгатори, які можна переважно застосовувати в цьому випадку, можуть бути без великих зусиль визначені кваліфікованим фахівцем в даній галузі і включають різні неіонні, аніонні, катіонні і амфотерні емульгатори, або суміш двох або більше емульгаторів. Приклади неіонних емульгаторів, придатних для отримання емульгованих концентратів, включають поліалкіленгліколеві прості ефіри і продукти конденсації алкіл- і арилфенолів, аліфатичних спиртів, аліфатичних амінів або жирних кислот з етиленоксидом, пропіленоксидами, такими як етоксировані алкілфеноли і ефіри карбонових кислот, солюбілізовані в поліолі або поліоксіалкілені. Катіонні емульгатори включають сполуки четвертинного амонію і солі жирних амінів. Аніонні емульгатори включають маслорозчинні солі (наприклад, кальцію) алкіларилсульфонових кислот, маслорозчинні солі або сульфатовані прості полігліколеві ефіри і відповідні солі фосфатованого простого полігліколевого ефіру.

Типові органічні рідини, які можна використовувати у разі отримання емульгованих концентратів сполук згідно з даним винаходом, являють собою ароматичні рідини, такі як ксилол, пропілбензольні фракції; або змішані нафталінові фракції, мінеральні масла, заміщені ароматичні органічні рідини, такі як діоктилфталат; гас; діалкіламіди різних жирних кислот, особливо, диметиламіди жирних гліколів і похідні гліколю, такі як простий н-бутиловий ефір, простий етиловий ефір або простий метиловий ефір діетиленгліколю і простий метиловий ефір триетиленгліколю і т. п. Суміші двох або більше органічних рідин також можна застосовувати у разі отримання емульгованого концентрату. Органічні рідини, включаючи ксилол і пропілбензольні фракції, разом з ксилолом є найбільш переважними в деяких випадках. Поверхнево-активні диспергатори звичайно застосовують в рідких композиціях і в кількості 0,1-20 мас. %, з розрахунку на загальну масу диспергатора з однією або більше сполуками. Композиції також можуть містити інші сумісні добавки, наприклад, регулятори росту рослин і інші біологічно активні сполуки, що використовуються в сільському господарстві.

Водні суспензії включають суспензії однієї або більше розчинних у воді сполук формули I, диспергованих у водному носії, при концентрації в діапазоні від приблизно 5 мас. % до приблизно 50 мас. %, з розрахунку на загальну масу водної суспензії. Суспензії отримують шляхом тонкого розмелювання однієї або більше сполук і енергійного змішування розмеленої речовини з носієм, що містить воду і поверхнево-активні речовини, вибрані з тих же самих типів, вказаних вище. Інші компоненти, такі як неорганічні солі і синтетичні або природні камеді, також можна додавати для збільшення густини і в'язкості водного носія. Часто найбільш

ефективно подрібнення і змішення одночасно при отриманні водної суміші і її гомогенізації можна здійснювати в приладі, такому як піщаний млин, кульовий млин або гомогенізатор поршневого типу.

Водні емульсії включають емульсії одного або більше нерозчинних у воді пестицидно активних інгредієнтів, емульгованих у водному носії, при концентрації, що звичайно знаходиться в діапазоні від приблизно 5 мас. % до приблизно 50 мас. %, з розрахунку на загальну масу водної емульсії. Якщо пестицидно активний інгредієнт є твердою речовиною, то він повинен бути розчинений у відповідному, незмішуваному з водою розчиннику перед отриманням водної емульсії. Емульсії отримують шляхом емульгування рідкого, пестицидно активного інгредієнта, або його незмішуваного з водою розчину, у водному середовищі, звичайно при включенні поверхнево-активних речовин, які сприяють утворенню і стабілізації емульсії, як описано вище. Цього часто досягають за допомогою енергійного перемішування, що забезпечується змішувачами з високим зсувним зусиллям або гомогенізаторами.

Сполуки формули I також можна наносити у вигляді гранульованих композицій, які особливо придатні для нанесення на ґрунт. Гранульовані композиції звичайно містять від приблизно 0,5 мас. % до приблизно 10 мас. %, з розрахунку на загальну масу гранульованої композиції, сполуки(сполук), диспергованої(их) в інертному носії, який повністю або переважно складається з грубо подрібненої інертної речовини, такої як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або подібна недорога речовина. Такі композиції звичайно отримують шляхом розчинення сполук у прийнятному розчиннику і нанесення на гранульований носій, який заздалегідь сформований до відповідного розміру частинок, в діапазоні від приблизно 0,5 мм до приблизно 3 мм. Прийнятним розчинником є розчинник, в якому сполука є по суті або повністю розчинною. Такі композиції також можна отримувати шляхом виготовлення тістоподібної маси або паст з носія і сполуки і розчинника, і розділення і сушіння до отримання бажаних гранульованих частинок.

Дусти, які містять сполуки формули I, можна отримувати шляхом ретельного змішування однієї або більше сполук в порошкоподібній формі з прийнятним сільськогосподарським носієм у вигляді дусту, таким як, наприклад, каолін, розмелена вулканічна гірська порода і т. п. Дусти можуть відповідним чином містити від приблизно 1 мас. % до приблизно 10 мас. % сполук, з розрахунку на загальну масу дусту.

Композиції можуть додатково містити допоміжні поверхнево-активні речовини для поліпшення осадження, зволоження і проникнення сполук в цільову сільськогосподарську культуру і організм-мішень. Ці допоміжні поверхнево-активні речовини необов'язково можна використовувати як компонент композиції або у вигляді резервуарної суміші. Кількість допоміжної поверхнево-активної речовини звичайно варіюється від 0,01 до 1,0 об. %, з розрахунку на розпилюваний об'єм води, переважно 0,05-0,5 об. %.

Придатні допоміжні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються ними, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або природні спирти, солі складних ефірів або сульфоянтарних кислот, етоксировані кремнійорганічні сполуки, етоксировані жирні аміни і суміші поверхнево-активних речовин з мінеральними маслами або рослинними оліями. Композиції можуть також включати емульсії масло-в-воді, такі як емульсії, описані в заявці на патент США № 11/495228, розкриття якої точно включене в даний контекст шляхом посилання.

Композиції необов'язково можуть включати комбінації, які містять інші пестицидні сполуки. Такі додаткові пестицидні сполуки можуть являти собою фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематоциди, мітициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні зі сполуками згідно з даним винаходом в середовищі, вибраному для нанесення, і не є антагоністичними по відношенню до активності сполук згідно з даним винаходом. Відповідно, в таких втіленнях іншу пестицидну сполуку використовують як додаткову отруйну речовину для того ж самого або для іншого пестицидного застосування. Сполуки формули I і пестицидна сполука в комбінації можуть звичайно знаходитися в масовому співвідношенні від 1:100 до 100:1.

Сполуки згідно з даним винаходом також можна комбінувати з іншими фунгіцидами з утворенням фунгіцидних сумішей і їх синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки згідно з даним винаходом часто застосовують в поєднанні з одним або більше іншими фунгіцидами для боротьби з великою різноманітністю небажаних хвороб. Коли використовують в поєднанні з іншим(и) фунгіцидом(ами), заявлені згідно з даним винаходом сполуки можуть бути складені для отримання композицій з іншим(и) фунгіцидом(ами), змішані в резервуарі з іншим(и) фунгіцидом(ами) або нанесені послідовно з іншим(и) фунгіцидом(ами). Такі інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатометилтіо)бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксифінолінсульфат, аметоктрадин, амисульбром, антимицин, *Ampelomyces quisqualis*, азаконазол, азоксистробін, *Bacillus subtilis*, штам *Bacillus subtilis* QST713, беналаксил, беноміл, бентіавакарб-ізопропіл, сіль бензиламінобензол-сульфонату (BABS), бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол,

біксафен, бластицидин-S, бура, бордоська рідина, боскалід, бромуконазол, біпіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, хлазафенон, хлоронеб, хлорталоніл, хлосолінат, *Coniothyrium minitans*, гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, сульфат міді (триосновний), оксид одновалентної міді, 5 ціазофамід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакарб, етиленбіс(дитіокарбамат) діамонію, дихлофлуанід, дихлорофен, диклоцимет, дикломезин, дихлоран, діетофенкарб, дифеноконазол, дифензокват-іон, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон, додеморф, додеморфацетат, додин, додин у вигляді вільної основи, едифенфос, енестробін, 10 епоксиконазол, етабоксам, етоксиквін, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, фторімід, флуоксастробін, флуквінказол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, 15 формальдегід, фозетил, фозетил-алюміній, фуберідазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатинацетати, GY-81, гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазаліл, імазалілсульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинтриацетат, іміноктадинтріс(альбесилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізіпіразам, ізіотіаніл, казугаміцин, казугаміцингідрохлоридгідрат, крезоксим-метил, ламінарин, манкопер, 20 манкозеп, мандипропамід, манеб, мепаніпірим, мепроніл, хлорид ртуті (II), оксид ртуті (II), хлорид ртуті (I), металаксил, мефеноксам, мептил-динокап, металаксил-М, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, метконазол, метасульфокарб, метилйодид, метилізіотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіоміцин, міклобутаніл, набам, нітротал-ізопропіл, нуаримол, октилінон, офурас, олеїнова кислота (жирні кислоти), 25 оризастробін, оксаксидил, оксин-мідь, окспоконазолфумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат, пентіопірад, фенілртуті ацетат, фосфонова кислота, фталід, пікоксистробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, гідроксидінолілсульфат калію, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарба гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, проквіназид, 30 протіоконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, пірокілон, квінокламін, квіноксифен, квінтозен, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, седаксан, силтіофам, симеконазол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірка, SYP-Z071, SYP-Z048, дігтярні масла, тебуконазол, тебуфлуквін, текназен, тетраконазол, 35 тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифурин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін, зинеб, зирам, зоксамід, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma* spp., (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл)-2- 40 (метоксиметил)сукцинімід, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетонгідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 1,1,4,4-тетраоксид 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіїну, 2-метоксіетилртуті ацетат, 2-метоксіетилртуті хлорид, 2-метоксіетилсилікат ртуті, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)фенілтіоціанатем, ампропілфос, анілазин, азитирам, полісульфід барію, Bayer 45 32394, беноданіл, бенквінокс, бенталурон, бензамакрил; бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бінапакрил, біс(метилртуть)сульфат, біс(трибутилолово)оксид, бутіобат, хроматсульфат кадмію, кальцію, міді і цинку, карбаморф, СЕСА, хлобентіазон, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорквінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол, ципрофурам, декафентин, дихлон, дихлосолін, диклобутразол, диметиримол, диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритіон, 50 диталімфос, додицин, дразоксолон, EBP, ESBP, етаконазол, етем, етирим, фенаміносальф, фенапаніл, фенітропан, 5-фторцитозин і його профунгіциди, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофульвін, галакринат, Hercules 3944, гексилтіофос, ICIA0858, ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксолон, метфуроксам, метилдиціандіамід ртуті, метсульфовакс, мілнеб, мукохлористий 55 ангідрид, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилмеркуріо-4-толуолсульфонанілід, біс(диметилдитіокарбамат) нікелю, OCH, фенілртуті диметилдитіокарбамат, фенілртуті нітрат, фосдифен, піколінамід UK-2A і його похідні, протіокарб; протіокарбу гідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксихлор, піроксифур, квінацетол; квінацетолсульфат, квіназамід, квінказол, рабензазол, саліциланілід, SSF-109,



сультропен, текорам, тіадифлуор, тиціофен, тіохлорфенфім, тіофанат, тіоквінокс, тіоксімід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихлорамід, урбацід і зариламід, і будь-які їх комбінації.

Додатково, сполуки згідно з даним винаходом можна комбінувати з іншими пестицидами, включаючи інсектициди, нематоциди, мітициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні із сполуками згідно з даним винаходом в середовищі, вибраному для нанесення, і не є антагоністичними по відношенню до активності сполук згідно з даним винаходом, для отримання пестицидних сумішей і їх синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки згідно з даним винаходом можна наносити в поєднанні з одним або більше іншими пестицидами для боротьби з великою різноманітністю небажаних комах-шкідників. Коли використовують в поєднанні з іншими пестицидами, заявлені згідно з даним винаходом сполуки можуть бути складені для отримання композицій з іншим(и) пестицидом(ами), змішані в резервуарі з іншим(и) пестицидом(ами) або нанесені послідовно з іншим(и) пестицидом(ами). Типові інсектициди включають, але не обмежуються ними: антибіотичні інсектициди, такі як алосамідин і турингієнсин; (макроциклічний лактон)-інсектициди, такі як спіносад і спінеторам; авермектинові інсектициди, такі як абабектин, дорабектин, емабектин, епріномектин, івермектин і селамектин; мілбеміцинові інсектициди, такі як лепібектин, мілбектин, мілбеміциноксим і моксидектин; миш'яковисті 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, джасмолін I, джасмолін II, піретрин I, піретрин II, касія, ротенон, гуаніа і сабадила; карбаматні інсектициди, такі як бендіокарб і карбарил; бензофуранілметилкарбаматні інсектициди, такі як бенфуракарб, карбофуран, карбосульфат, декарбофуран і фуратіокарб; диметилкарбаматні інсектициди димітан, диметилан, гівінкарб і піримікарб; оксимкарбаматні інсектициди, такі як аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, бутоксикарб, бутоксикарб, метоміл, нітрилакарб, оксаміл, тазимкарб, тіокарб, тіодикарб і тіофанокс; фенілметилкарбаматні інсектициди, такі як аліксикарб, амінокарб, буфенкарб, бутаккарб, карбанолат, клоетоккарб, дикрезил, діоксикарб, ЕМРС, етіофенкарб, фенетаккарб, фенобукарб, ізопрокарб, метіокарб, метолкарб, мексикарбат, промазил, промеккарб, пропоксур, триметаккарб, ХМС і ксилілкарб; вологопоглинальні інсектициди, такі як борна кислота, діатомова земля і силікагель; діамідні інсектициди, такі як хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; динітрофенольні інсектициди, такі як динекс, динопрол, диносам і DNOC; фторвмісні інсектициди, такі як гексафторсилікат барію, кріоліт, фторид натрію, гексафторсилікат натрію і сульфлурамід; формамідинові інсектициди, такі як амітраз, хлордимеформ, форметанат і формпаранат; фумігантні інсектициди, такі як акрилонітріл, сірковуглець, чотиріхлористий вуглець, хлороформ, хлорпікрин, парадихлорбензол, 1,2-дихлорпропан, етилформіат, етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, ціаністий водень, йодметан, метилбромід, метилхлороформ, метилхлорид, нафталін, фосфін, сульфурилфторид і тетрафлоретан; неорганічні інсектициди, такі як бура, полісульфід кальцію, олеат міді, хлорид ртуті, тіоціанат калію і тіоціанат натрію; інгібітори синтезу хітину, такі як бістріфлуорон, бупрофезин, хлорфлуазурон, циромазин, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлумурон, пенфлуорон, тефлубензурон і трифлумурон; міметики ювенільного гормону, такі як епофенонан, феноксикарб, гідропрен, кинопрен, метопрен, пірипроксифен і трипрен; ювенільні гормони, такі як ювенільний гормон I, ювенільний гормон II і ювенільний гормон III; агоністи гормону 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-аналоги нерейстоксину, такі як бенсультап, картап, тіоциклам і тіосультап; нікотиніди інсектициди, такі як флонікамід; нітрогуанідинові інсектициди, такі як клотіанідин, динотифуран, імідаклоприд і тіаметоксам; нітромаєтиленові інсектициди, такі як нітенпірам і нітіазин; піридилметиламінові інсектициди, такі як ацетаміприд, імідаклоприд, нітенпірам і тіаклоприд; хлорорганічні інсектициди, такі як бром-DDT, камфехлор, DDT, pp'-DDT, етил-DDD, HCH, гамма-HCH, ліндан, метоксихлор, пентахлорфенол і TDE; циклодієнові інсектициди, такі як альдрин, бромциклен, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, діельдрин, дилор, ендосульфат, альфа-ендосульфат, ендрин, HEOD, гептахлор, HHDN, ізобензан, ізодрин, келеван і мірекс; органофосфатні інсектициди, такі як бромфенвінфос, хлорфенвінфос, кротоксифос, дихлорвос, дикротоксифос, диметилвінфос, фоспірат, гептенофос, метокротоксифос, мевінфос, монокротоксифос, налед, нафталоксифос, фосфамідон, пропафос, TEPP і тетрахлорвінфос; органотіофосфатні інсектициди, такі як діоксаксифос, фосметилан і фентоат; аліфатичні органотіофосфатні інсектициди, такі як ацетіон, амітон, кадусафос, хлоретоксифос, хлормефос, демефінон, демефінон-O, демефінон-S, деметон, деметон-O, деметон-S, деметон-метил, деметон-O-метил,

деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, дисульфотон, етiон, етопрофос, IPSP, iзотiоат, малатiон, метакрифос, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, форат, сульфотеп, тербуфос i тiометон; алiфатичнi амiдорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як амiдитiон, цiантоат, диметоат, етоат-метил, формотiон, мекарбам, ометоат, протоат, софамiд i

5 вамiдотiон; оксиморганотiофосфатнi iнсектициди, такi як хлорфоксим, фоксим i фоксим-метил; гетероциклiчнi органотiофосфатнi iнсектициди, такi як азаметифос, кумафос, кумiтоат, дiоксатiон, ендотiон, меназон, морфотiон, фосалон, пiраклофос, пiридафентiон i квiнотiон; бензотiопiранорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як дитикрофос i тикрофос; бензотриазинорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як азинфос-етил i азинфос-метил;

10 iзоiндолорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як дiалiфос i фосмет; iзоксазолорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як iзоксатiон i золапрофос; пiразолопiримiдинорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як хлорпразофос i пiразофос; пiридинорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як хлорпiрифос i хлорпiрифос-метил; пiримiдинорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як бутатiофос, дiазинон, етримфос, лiримфос, пiримiфос-етил, пiримiфос-метил, примiдофос, пiримитат i тебупiримфос;

15 хiноксалiнорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як хiналфос i хiналфос-метил; тiадiазолорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як атидатiон, лiтидатiон, метидатiон i протидатiон; триазолорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як iзазофос i триазофос; фенiлорганотiофосфатнi iнсектициди, такi як азотоат, бромфос, бромфос-етил, карбофенотiон, хлортiофос, цiанофос, цитiоат, дикаптон, дихлофентiон, етафос, фамфур, фенхлорфос, фенiтротiон, фенсульфотiон,

20 фентiон, фентiон-етил, гетерофос, йодфенфос, месульфенфос, паратiон, паратiон-метил, фенкаптон, фоснiхлор, профенофос, протiофос, сульфпрофос, темефос, трихлорметафос-3 i трифенофос; фосфонатнi iнсектициди, такi як бутонат i трихлорфон; фосфонотiоатнi iнсектициди, такi як мекарфон; фенiлетилфосфонотiоатнi iнсектициди, такi як фонофос i трихлоронат; фенiлфенiлфосфонотiоатнi iнсектициди, такi як цiанофенфос, EPN i лептофос;

25 фосфорамiдатнi iнсектициди, такi як круфомат, фенамiфос, фостiетан, мефосфолан, фосфолан i пiриметафос; фосфорамiдотiоатнi iнсектициди, такi як ацефат, iзокарбофос, iзофенфос, iзофенфос-метил, метамiдофос i пропетамфос; фосфордiамiднi iнсектициди, такi як димефокс, мазидокс, мiпафокс i шрадан; оксадiазиновi iнсектициди, такi як индоксакарб; оксадiазолiновi iнсектициди, такi як метоксадiазон; фталiмiднi iнсектициди, такi як дiалiфос, фосмет i

30 тетраметрин; пiразольнi iнсектициди, такi як тебуфенпiрад, толефенпiрад; фенiлпiразольнi iнсектициди, такi як ацетопрол, етипрол, фiпронiл, пiрафлупрол, пiрипрол i ванiлiпрол; iнсектициди на основi складного пiретроiдного ефiру, такi як акринатрин, алетрин, бiоалетрин, бартрин, бiфентрин, бiоетанометрин, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин, дельтаметрин, димефлутрин,

35 диметрин, емпентрин, фенфлутрин, фенпiритрин, фенпропатрин, фенвалерат, есфенвалерат, флуцитринат, флувалiнат, тау-флувалiнат, фуретрин, iмiпротрин, меперфлутрин, метофлутрин, перметрин, бiоперметрин, трансперметрин, фенотрин, пралетрин, профлутрин, пiресметрин, ресметрин, бiоресметрин, цисметрин, тефлутрин, тералетрин, тетраметрин,

40 тетраметилфлутрин, тралометрин i трансфлутрин; iнсектициди на основi простого пiретроiдного ефiру, такi як етофенпрокс, флуфенпрокс, галфенпрокс, протрифенбут i силафлуофен; пiридинамiновi iнсектициди, такi як флуфенерим i пiримiдифен; пiрольнi iнсектициди, такi як хлорфенапiр; iнсектициди на основi тетрамової кислоти, такi як спiротетрамат; iнсектициди на основi тетронової кислоти, такi як спiромезифен; iнсектициди на основi тiосечовини, такi як

45 дiафентiурон; iнсектициди на основi сечовини, такi як флукофурон i сулкофурон; i некласифiкованi iнсектициди, такi як клозантел, нафтенат мiдi, кротамитон, EXD, феназафлор, феноксакрим, гiдраметилнон, iзопротiолан, малонобен, метафлумiзон, нифлуридид, плiфенат, пiридабен, пiридалiл, пiрифлуквiназон, рафоксанiд, сульфоксафлор, триаратен i триазамат, i їх будь-якi комбiнацiї.

50 Додатково, сполуки згiдно з даним винаходом можна комбiнувати з гербiцидами, якi сумiснi iз сполуками згiдно з даним винаходом в середовищi, вибраному для нанесення, i не є антагонiстичними по вiдношенню до активностi сполук згiдно з даним винаходом, з утворенням пестицидних сумiшей i їх синергiчних сумiшей. Фунгiциднi сполуки згiдно з даним винаходом можна наносити в поєднаннi з одним або бiльше гербiцидами для боротьби з великою

55 рiзноманiтнiстю небажаних рослин. Коли використовують в поєднаннi з гербiцидами, заявленi згiдно з даним винаходом сполуки можуть бути складенi для отримання композицiй з гербiцидом(ами), змiшанi в резервуарi з гербiцидом(ами) або нанесенi послiдовно з гербiцидом(ами). Типовi гербiциди включають, але не обмежуються ними: амiднi гербiциди, такi як алiдохлор, бефлубутамiд, бензадокс, бензипрам, бромобутид, кафенстрол, CDEA, ципразол,

60 диметенамiд, диметенамiд-Р, дифенамiд, епроназ, етнiпромiд, фентразамiд, флупоксам,

фомезафен, галозафен, ізокарбамід, ізоксабен, напропамід, напталам, петоксамід, пропізамід, хінонамід і тебутам; анілідні гербіциди, такі як хлоранокрил, цисанлід, кломеппроп, ципромід, дифлуфенікан, етобензанід, фенасулам, флуфенацет, флуфенікан, мефенацет, мефлуїдид, метаміфоп, моналід, напроанлід, пентанохлор, піколінафен і пропаніл; арилаланінові гербіциди, такі як бензоїлпроп, флампроп і флампроп-М; хлорацетанлідні гербіциди, такі як ацетохлор, алахлор, бутахлор, бутенахлор, делахлор, диетатил, диметлахлор, метазлахлор, метолахлор, S-метолахлор, претилахлор, пропахлор, пропізохлор, принахлор, тербухлор, тенілхлор і ксилахлор; сульфоналідні гербіциди, такі як бензофлуор, перфлуїдон, піримісульфан і профлуазол; сульфонамідні 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-ТВА і трикамба; гербіциди на основі піримідинілоксибензойної кислоти, такі як біспірибак і піримінобак; гербіциди на основі піримідинілтіобензойної кислоти, такі як піритіобак; гербіциди на основі фталевої кислоти, такі як хлортал; гербіциди на основі піколінової кислоти, такі як амінопіралід, клопіралід і піклорам; гербіциди на основі хінолінкарбонової кислоти, такі як хінклорак і хінмерак; гербіциди на основі миш'яку, такі як какодилова кислота, СМА, DSMA, гексафлуорат, МАА, МАМА, MSMA, арсеніт калію і арсеніт натрію; бензоїлциклогександіонові гербіциди, такі як мезотрион, сулкотрион, тефурилтрион і темботрион; бензофуранілалкілсульфонатні гербіциди, такі як бенфурезат і етофумезат; бензотіазольні гербіциди, такі як бензазолін; карбаматні гербіциди, такі як асулам, карбоксазол хлорпрокарб, дихлормат, фенасулам, карбутилат і тербукарб; карбанілатні гербіциди, такі як барбан, ВСРС, карбасулам, карбетамід, СЕРС, хлорбуфам, хлорпрофам, СРРС, десмедифам, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, профам і свеп; циклогексеноксимові гербіциди, такі як алоксидим, бутроксидим, клетодим, клопроксидим, циклоксидим, профоксидим, сетоксидим, тепралоксидим і тралкоксидим; гербіциди на основі циклопропілізоксазолу, такі як ізоксахлортол і ізоксафлутол; дикарбоксимідні гербіциди, такі як цинідон-етил, флумезин, флуміклорак, флуміоксазин і флуміпролін; динітроанілінові гербіциди, такі як бенфлуралін, бутралін, динітрамін, еталфлуралін, флухлоралін, ізопропалін, металпропалін, нітралін, оризалін, пендиметалін, продіамін, профлуралін і трифлуралін; динітрофенольні гербіциди, такі як динофенат, динопроп, динозам, динозеб, динотерб, DНОС, етинофен і мединотерб; гербіциди на основі простого дифенілового ефіру, такі як етоксифен; гербіциди на основі простого нітрофенілового ефіру, такі як ацифлуорфен, аклоніфен, бифенокс, хлометоксифен, хлорнітрофен, етніпромід, флуородифен, флуороглікофен, флуоронітрофен, фомезафен, фурилоксифен, галозафен, лактофен, нітрофен, нітрофлуорфен і оксифлуорфен; дітіокарбаматні гербіциди, такі як дазомет і метам; гербіциди на основі аліфатичних галогенованих сполук, такі як алорак, хлоропон, далапон, флупропанат, гексахлорацетон, йодметан, метилбромід, монохлороцтова кислота, SMA і TCA; імідазолінонові гербіциди, такі як імазаметабенз, імазамокс, імазапін, імазапін, імазахін і імазетапін; неорганічні гербіциди, такі як сульфамат амонію, бура, хлорат кальцію, сульфат заліза, азид калію, ціанат калію, азид натрію, хлорат натрію і сірчана кислота; нітрильні гербіциди, такі як бромобоніл, бромоксиніл, хлороксиніл, дихлобеніл, йодобоніл, йоксиніл і піраклоніл; гербіциди на основі фосфорорганічних сполук, такі як аміпрофос-метил, анілофос, бенсулід, біланафос, бутаміфос, 2,4-DEP, DMPA, ЕВЕР, фосамін, глуфозинат, глуфозинат-Р, гліфосат і піперофос; фенокси-гербіциди, такі як бромфеноксим, кломеппроп, 2,4-DEB, 2,4-DEP, дифенопентен, дисул, ербон, етніпромід, фентеракол і трифопсим; оксадіазолінові гербіциди, такі як метазол, оксادیаргіл, оксадіазон; оксазольні гербіциди, такі як феноксасульфон; феноксиоцтові гербіциди, такі як 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-тіоетил і 2,4,5-T; феноксимасляні гербіциди, такі як 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB і 2,4,5-TB; феноксипропіонові гербіциди, такі як клопроп, 4-CPР, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, 3,4-DP, фенопроп, мекопроп і мекопроп-Р; арилоксифеноксипропіонові гербіциди, такі як хлоразифоп, клодинафоп, клофоп, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, феноксапроп-Р, фентіапроп, флуазифоп, флуазифоп-Р, галоксифоп, галоксифоп-Р, ізоксапирифоп, метамифоп, пропаквизафоп, квизалофоп, квизалофоп-Р і трифоп; фенілєндіамінові гербіциди, такі як динітрамін і продіамін; піразольні гербіциди, такі як пироксасульфоп; 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, дімідазон, флуфенпін, метфлуразон, норфлуразон, оксапіразон і піданон; піридинові гербіциди, такі як амінопіралід, кліюдинат, клопіралід, дітіопір, флуороксіпін, галоксидин, піклорам, піколінафен, піриклор, тіазопір і триклопін; піримідиндіамінові гербіциди, такі як іпрімідам і тіоклорим; четвертинні амонієві гербіциди, такі як циперкват, діетамкват, дифензокват, дикват, морфамкват і паракват;

тіокарбаматні гербіциди, такі як бутилат, циклоат, ди-алат, ЕРТС, еспрокарб, етіолат, ізополінат, метіобенкарб, молінат, орбенкарб, пебулат, просульфоккарб, пірибутикарб, сульфалат, тіобенкарб, тіокарбазил, три-алат і вернолат; тіокарбонатні гербіциди, такі як димексано, EXD і проксан; гербіциди на основі тіосечовини, такі як метіурон; 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, азипротрин, ціанатрин, десметрин, диметаметрин, метопротрин, прометрин, симетрин і тербутрин; триазинонові гербіциди, такі як аметридін, амибузин, гексазинон, 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, пеноксулам і піроксулам; гербіциди на основі урацилу, такі як бензфендизон, бромацил, бутафенацил, флупропазил, ізоцил, ленацил, сафлуфенацил і тербацил; гербіциди на основі сечовини, такі як бензтіазурон, кумилурон, циклурон, дихлоральсечовина (дихлоралькарбамід), дифлуфензопир, ізонорурон, ізоурон, метабензтіазурон, монісоурон і норурон; гербіциди на основі фенілсечовини, такі як анізурон, бутурон, хлорбромурон, хлоретурон, хлортолурон, хлороксурон, даймурон, дифеноксурон, димефурон, діурон, фенурон, флуометурон, флуотиурон, ізопротурон, линурон, метиурон, метилдимурон, метобензурон, метобромурон, метоксурон, монолінурон, монурон, небурон, парафлурон, фенобензурон, сидурон, тетрафлурон і тидіазурон; піримідинісульфонілкарбамідні гербіциди, такі як амідосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон, хлоримурон, циклосульфамурон, етоксисульфурон, флазасульфурон, флуцетосульфурон, флупірсульфурон, форамсульфурон, галосульфурон, імазосульфурон, мезосульфурон, метазосульфурон, нікосульфурон, ортосульфамурон, оксасульфурон, примісульфурон, пропірисульфурон, піразосульфурон, римсульфурон, сульфометурон, сульфосульфурон і трифлорисульфурон; триазинісульфонілкарбамідні гербіциди, такі як хлоросульфурон, циносульфурон, етаметсульфурон, йодосульфурон, метсульфурон, просульфурон, тифенсульфурон, триасульфурон, трибенурон, трифлосульфурон і тритосульфурон; тіадіазолілкарбамідні гербіциди, такі як бутіурон, етидимурон, тебутіурон, тіазафлурон і тидіазурон; і некласифіковані гербіциди, такі як акролеїн, аліловий спирт, аміноциклопірахлор, азафенідин, бентазон, бензобіциклон, біциклопірон, бутидазол, ціанамід кальцію, камбендихлор, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, цинметилін, кломазон, CPMF, крезол, ціанамід, орто-дихлорбензол, димепіперат, ендотал, флуоромідин, флуридон, флуорохлоридон, флуртамон, флутіацет, інданофан, метилізотіоціанат, OCH, оксазикломефон, пентахлорфенол, пентоксазон, фенілртуті ацетат, просульфалін, пірибензоксим, пірифталід, хінокламін, родетаніл, сулглікапін, тидіазимин, тридифан, триметурон, трипропіндан і тритак.

Інше втілення даного винаходу являє собою спосіб боротьби або запобігання грибовій атаці. Цей спосіб включає нанесення фунгіцидно ефективною кількості однієї або більше сполук формули I на ґрунт, рослину, коріння, листя, насіннєвий матеріал або місцеположення грибка або на місце, де повинне бути відвернене зараження паразитами (наприклад, нанесення на зернові або виноградні рослини). Сполуки є прийнятними для обробки різних рослин на фунгіцидних рівнях, в той же час виявляючи низьку фітотоксичність. Сполуки можуть бути придатні як у вигляді захисного засобу, так і/або у формі, яка знищує шкідників.

Знайдено, що сполуки мають значний фунгіцидний ефект, особливо для сільськогосподарського застосування. Велика кількість сполук особливо ефективні для застосування у разі сільськогосподарських культур і плодових рослин. Додаткові переваги можуть включати, але не обмежуючись цим, поліпшення життєздатності рослини; збільшення врожайності рослини (наприклад, збільшення біомаси і/або збільшення вмісту цінних інгредієнтів); збільшення потужності рослини (наприклад, поліпшення зростання рослини і/або зелені листя); поліпшення якості рослини (наприклад, поліпшення вмісту або композиції деяких інгредієнтів); і підвищення стійкості до абіотичного і/або біотичного стресу рослини.

Фахівцям в даній галузі повинно бути зрозумілим, що ефективність сполуки відносно вищезазначених грибків доводить загальну корисність сполук як фунгіцидів.

Сполуки мають широкий діапазон активності проти грибкових хвороботворних мікроорганізмів.

Приклади хвороботворних мікроорганізмів можуть включати, але не обмежуючись ними, септоріоз листя пшениці (*Septoria tritici*, також відома як *Mycosphaerella graminicola*), парша яблук (*Venturia inaequalis*) і церкоспороз, плямистість листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і інших сільськогосподарських культур, і чорна гнилизна у разі бананів (*Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість активної речовини, що наноситься, залежить не тільки від конкретної активної речовини, яку треба нанести, але також і від бажаного конкретного впливу, виду грибка, з яким треба боротися, і стадії його зростання, а також частини рослини або іншого продукту, що знаходиться в контакті зі сполукою. Таким чином, всі сполуки і композиції, які їх містять, не можуть бути однаково ефективними при подібних концентраціях або проти одного і того ж виду грибків.

Сполуки є ефективними при використанні у разі рослин в інгібуючому захворювання і ботанічно прийнятній кількості. Термін "інгібуюче захворювання і ботанічно прийнятна кількість" стосується кількості сполуки, яка ліквідує або інгібує хворобу рослини, з якою необхідно боротися, але не є по суті токсичною відносно рослини. Ця кількість звичайно складає від приблизно 0,1 до приблизно 1000 ч./млн. (частин на мільйон), переважно, 1-500 ч./млн. Точну кількість сполуки необхідно варіювати в залежності від грибкового захворювання, з яким необхідно боротися, використовуюваного типу композиції, способу нанесення, конкретного виду рослини, кліматичних умов і т. п. Прийнятно наносима доза звичайно знаходиться в діапазоні від приблизно 0,10 до приблизно 4 фунт/акр (приблизно 0,01-0,45 грамів на квадратний метр, г/м<sup>2</sup>).

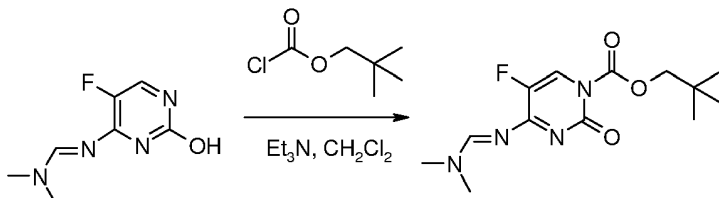
Будь-який діапазон або бажана величина, вказаний(на) в даному контексті, може бути розширений(збільшена) або змінений(на) без втрати шуканих ефектів, як очевидно для кваліфікованого фахівця відносно розуміння аспектів даного контексту.

Сполуки формули I можна отримувати, використовуючи добре відомі хімічні методики. Проміжні продукти, конкретно не вказані в даному описі, є або комерційно доступними, причому можуть бути отримані шляхами, описаними в хімічній літературі, або можуть бути без великих зусиль синтезовані з комерційно доступних вихідних речовин з використанням стандартних методик.

Наступні приклади представлені для ілюстрації різних аспектів сполук згідно з даним винаходом і не можуть тлумачитися як обмежуючі формулу винаходу.

#### Приклад 1

Отримання 2,2-диметилпропілового ефіру 4-(диметиламінометиленаміно)-5-фтор-2-оксо-2Н-піримідин-1-карбонової кислоти (1)



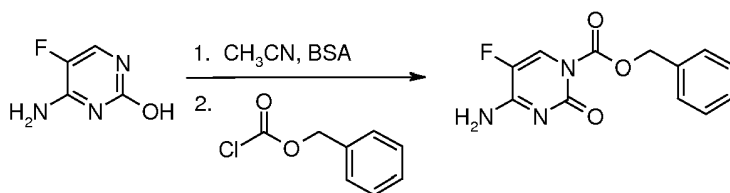
У пробірку з загвинчуваною кришкою ємністю 8 мл додають дихлорметан (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>; 3 мілілітри (мл)), N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N, N-диметилформамідин (100 міліграмів (мг), 0,54 мілімоль (ммоль)), триетиламін (Et<sub>3</sub>N; 120 мг, 1,18 ммоль) і 2,2-диметилпропілхлорформіат (90 мг, 0,60 ммоль). Після струшування протягом 1,5 годин (год.) при кімнатній температурі суміш розподіляють між етилацетатом (EtOAc) і водою (H<sub>2</sub>O). Органічну фазу сушать над сульфатом магнію (MgSO<sub>4</sub>), відфільтровують і випарюють. Сиру речовину очищають за допомогою хроматографії з оберненою фазою, отримуючи 2,2-диметилпропіловий ефір 4-(диметиламінометиленаміно)-5-фтор-2-оксо-2Н-піримідин-1-карбонової кислоти у вигляді твердої речовини білого кольору (33 мг, вихід 20 %), температура плавлення становить 162-164°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,77 (с, 1H), 7,93 (д, J=6,6 Гц, 1H), 4,08 (с, 2H), 3,27 (с, 3H), 3,20 (с, 3H), 1,05 (с, 9H); ESIMS m/z: 299 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуки 23-26 отримують, використовуючи аналогічну методику прикладу 1.

#### Приклад 2

Отримання бензил 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилату (2)



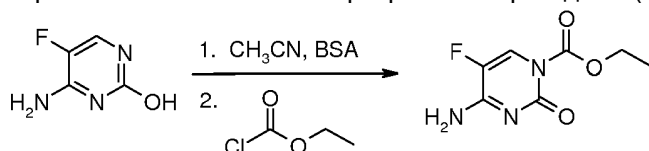
До суспензії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу\* (0,5 г, 3,87 ммоль) в ацетонітрилі (CH<sub>3</sub>CN; 10 мл) додають N, O-біс(триметилсиліл)ацетамід (BSA; 1,42 мл, 5,81 ммоль), і суміш нагрівають при температурі 55°C протягом 1,5 годин. Отриманий розчин охолоджують до кімнатної температури і до нього додають бензилхлорформіат (1,38 мл, 9,67 ммоль), викликаючи слабку екзотермічну реакцію. Через 10 хвилин (хв.) утворюється осад білого кольору, який залишають перемішуватися при кімнатній температурі протягом ночі. Тверду речовину відфільтровують під вакуумом і промивають діетиловим ефіром (Et<sub>2</sub>O; 2×10 мл), CH<sub>3</sub>CN (1×3 мл) і знову Et<sub>2</sub>O (2×10 мл), отримуючи бензил 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилат (0,515 г, вихід 50 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 212-215°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8,35 (с, 1H), 8,07 (с, 1H), 8,04 (д, J=7,25 Гц, 1H), 7,48-7,45 (м, 2H), 7,41-7,34 (м, 3H), 5,32 (с, 2H); ESIMS m/z: 264 ([M+H]<sup>+</sup>).

\*4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол може бути комерційно доступний.

#### Приклад 3

Отримання етил 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилату (3)

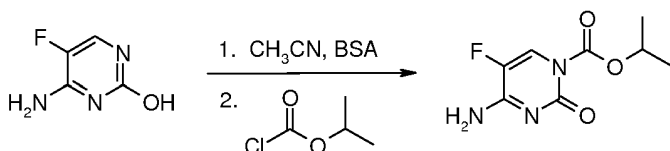


Використовуючи методику прикладу 2, піддають взаємодії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол (0,25 г, 1,9 ммоль), BSA (1,41 мл, 5,8 ммоль) і етилхлорформіат (0,277 мл, 2,9 ммоль), і отриману речовину очищають за допомогою хроматографії з оберненою фазою (градієнт, CH<sub>3</sub>CN/H<sub>2</sub>O), отримуючи етил 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилат (0,098 г, вихід 25,6 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 190-193°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8,29 (с, 1H), 8,04-8,01 (м, 2H), 4,27 (кв, J=7,25 Гц, 2H), 1,26 (т, J=7,25 Гц, 3H); ESIMS m/z: 200 ([M-H]<sup>-</sup>).

#### Приклад 4

Отримання ізопропіл 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилату (4)

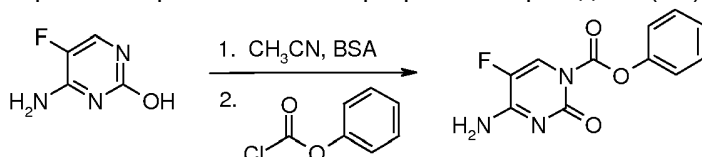


Використовуючи методику прикладу 2, піддають взаємодії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол (0,25 г, 1,9 ммоль), BSA (1,41 мл, 5,8 ммоль) і ізопропілхлорформіат (1 М розчин в толуолі; 2,9 мл, 2,9 ммоль), і отриману речовину очищають за допомогою хроматографії з оберненою фазою (градієнт, CH<sub>3</sub>CN/H<sub>2</sub>O), отримуючи ізопропіл 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилат (0,225 г, вихід 55 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 217-219°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8,28 (с, 1H), 8,02-7,99 (м, 2H), 4,97 (септет, J=6,26 Гц, 1H), 1,28 (д, J=6,26 Гц, 6H); ESIMS m/z: 216 ([M+H]<sup>+</sup>).

#### Приклад 5

Отримання фенол 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилату (5)



До суспензії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу (1,0 г, 7,74 ммоль) в CH<sub>3</sub>CN (20 мл) додають BSA (2,84 мл, 11,61 ммоль) і суміш нагрівають при температурі 65°C протягом 1 години. Отриманий розчин охолоджують до кімнатної температури і до нього додають

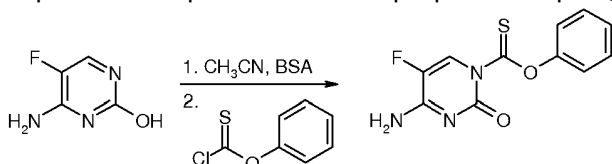
фенілхлорформіат (2,4 мл, 19,35 ммоль), викликаючи слабку екзотермічну реакцію. Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом ночі. Суспензію, яка утворюється, відфільтровують під вакуумом і тверду речовину промивають Et<sub>2</sub>O (3×10 мл). Тверду речовину суспендують в Et<sub>2</sub>O (10 мл) протягом 2 годин, збирають фільтрацією під вакуумом і висушують на повітрі протягом ночі. Виділяють феніл 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилат (0,90 г, вихід 47 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 175-180°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 9,25 (уш.с, 2H), 8,45 (д, J=7,25 Гц, 1H), 7,49-7,43 (м, 2H), 7,35-7,28 (м, 3H); ESIMS m/z: 250 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуки 6-20 отримують, використовуючи аналогічну методику прикладу 5.

Приклад 6

Отримання О-феніл 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карботіоату (21)

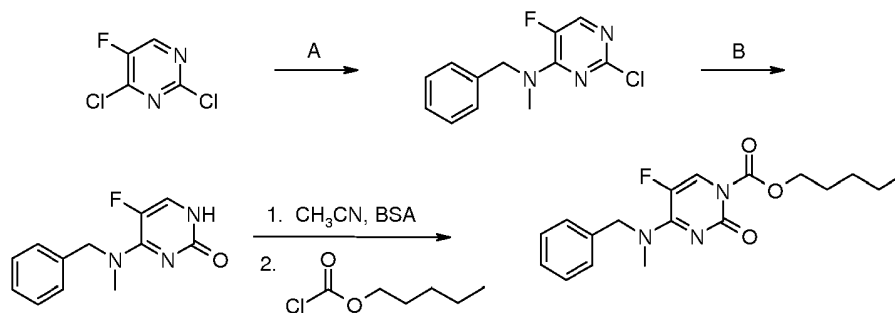


У пробірку з загвинчуваною кришкою ємністю 25 мл вводять 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол (99,7 мг, 0,772 ммоль) і CH<sub>3</sub>CN (3 мл). Додають BSA (0,284 мл, 1,16 ммоль), пробірку закривають і отриману гетерогенну суміш струшують в ротаційному струшуючому пристрої при температурі 65°C протягом 80 хвилин. Отриманий прозорий і безбарвний розчин охолоджують до кімнатної температури. Додають О-фенілкарбонхлоридотіоат (0,118 мл, 0,853 ммоль) і реакційну суміш струшують в ротаційному струшуючому пристрої при температурі 65°C протягом 15 годин. Після охолодження до кімнатної температури сирю речовину розбавляють CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (100 мл) і промивають насиченим водним розчином хлориду натрію (насичений водний розчин NaCl) (2×50 мл). Органічний розчин потім сушать над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, відфільтровують і концентрують у вакуумі. Залишок зелено-коричневого кольору потім очищають за допомогою хроматографії з нормальною фазою (градієнт, 0-35 % метиловий спирт (MeOH)/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), отримуючи О-феніл 4-аміно-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карботіоат (60,7 мг, вихід 30 %) у вигляді твердої речовини коричневого кольору з 85 % чистоти, температура плавлення становить 113-116°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8,56 (с, 1H), 8,44 (д, J=7,2 Гц, 1H), 8,28 (с, 1H), 7,56-7,48 (м, 2H), 7,40-7,33 (м, 1H), 7,27-7,21 (м, 2H); ESIMS m/z: 266 ([M+H]<sup>+</sup>).

Приклад 7

Отримання пентил 4-(бензил(метил)аміно)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилату (22)



А) До суспензії 2,4-дихлор-5-фторпіримідину (0,30 г, 1,80 ммоль) в діоксані (3,6 мл) додають 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 перемішують при кімнатній температурі протягом 16 годин. Реакційну суміш розбавляють EtOAc (15 мл) і отриманий розчин промивають H<sub>2</sub>O (2×5 мл). Органічну фазу сушать над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, відфільтровують і концентрують у вакуумі, отримуючи масло світло-жовтого кольору, яке очищають за допомогою хроматографії з нормальною фазою (40 г SiO<sub>2</sub>; градієнт, EtOAc/гексани), отримуючи безбарвне масло, яке отверджується при охолодженні. Тверду речовину сушать у високому вакуумі при температурі 23°C протягом 16 годин, отримуючи N-бензил-2-хлор-5-фтор-N-метилпіримідин-4-амін (0,34 г, вихід 76 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 47-49°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 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); ESIMS m/z: 251 (M)<sup>+</sup>.

В) До суспензії N-бензил-2-хлор-5-фтор-N-метилпіримідин-4-аміну (0,075 г, 0,30 ммоль) в суміші діоксан/H<sub>2</sub>O (1:1, 2 мл загального об'єму) додають гідроксид калію (KOH; 0,17 г, 3,0 ммоль). Суміш нагрівають до температури 100°C і перемішують протягом 72 годин. Реакційну суміш розбавляють H<sub>2</sub>O (5 мл) і рН доводять до 7 за допомогою 2 н. розчину HCl. Отриманий осад білого кольору збирають шляхом вакуумної фільтрації, але більша частина продукту залишається у водній фазі. Тверду речовину і фільтрат об'єднують і розчинник видаляють за допомогою азеотропної дистиляції з CH<sub>3</sub>CN у вакуумі. Залишок розчиняють/суспендують в CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (25 мл), адсорбують на целіті (3,0 г) і очищають за допомогою хроматографії з нормальною фазою (24 г SiO<sub>2</sub>; градієнт, MeOH/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), отримуючи 4-(бензилметиламіно)-5-фторпіримідин-2-ол (0,016 г, вихід 23 %) у вигляді твердої речовини білого кольору, температура плавлення становить 122,8-123,6°C.

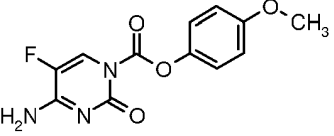
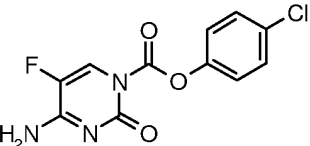
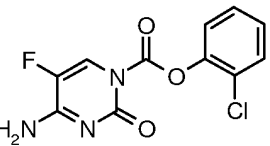
<sup>1</sup>H-ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 12,72 (с, 1H), 7,42-7,14 (м, 6H), 4,88 (с, 2H), 3,20 (д, J=3,2, 3H); ESIMS m/z: 235 (M+2)<sup>+</sup>, 232 (M-H)<sup>-</sup>.

С) До перемішаного розчину 4-(бензил(метил)аміно)-5-фторпіримідин-2(1H)-ону (0,200 г, 0,858 ммоль) в CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (18 мл) додають N-пентилхлорформіат (0,142 г, 0,944 ммоль) і Et<sub>3</sub>N (0,263 мл, 1,88 ммоль) при температурі 0°C. Суміш залишають нагріватися до кімнатної температури і перемішують ще 3 години. Сиру реакційну суміш випаровують досуха і залишок розтирають з метил-трет-бутиловим ефіром (MTBE; 4×5 мл) для видалення гідрохлориду триетиламіну. Об'єднані органічні шари випаровують у вакуумі. Сирий продукт очищають за допомогою хроматографії із оберненою фазою. Виділяють пентил 4-(бензил(метил)аміно)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксилат (20,1 мг, вихід 6,7 %) у вигляді смолоподібної речовини жовтого кольору.

<sup>1</sup>H-ЯМР (метанол-d<sub>4</sub>) δ 8,04 (д, J=6,2 Гц, 1H), 7,38-7,25 (м, 5H), 4,24 (т, J=6,6 Гц, 2H), 3,21 (д, J=3,3 Гц, 2H), 1,78-1,65 (м, 3H), 1,37 (дд, J=9,2, 5,5 Гц, 6H), 0,92 (т, J=7,1 Гц, 3H); ESIMS m/z: 348 ([M+H]<sup>+</sup>).

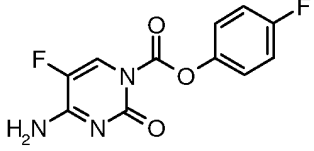
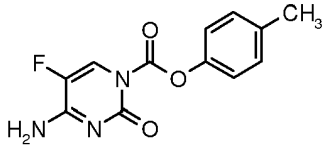
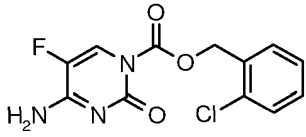
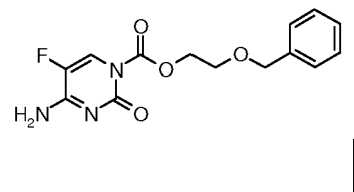
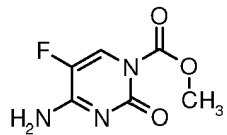
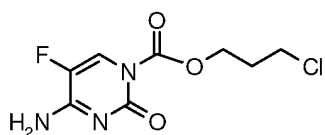
Таблиця I

Сполуки і зв'язані з їх характеристикою дані

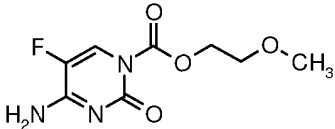
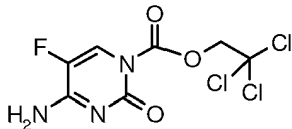
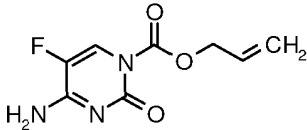
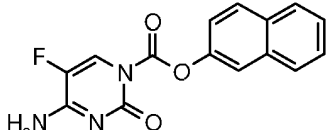
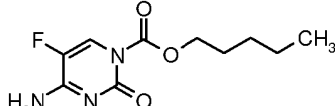
Спол.	Структура	Зовнішній вигляд	Т. пл. (°C)	MS	<sup>1</sup> H-ЯМР (δ, DMSO-d <sub>6</sub> ), якщо не вказано інше
6		не зовсім біла тверда речовина	172,4-173,6	ESIMS m/z 280 [M+H] <sup>+</sup>	8,65 (с, 1H), 8,52 (с, 1H), 8,31 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,23 (д, J=9,0 Гц, 2H), 7,01 (д, J=9,1 Гц, 2H), 3,78 (с, 3H)
7		біла тверда речовина	143,2-146,3	ESIMS m/z 284 [M+H] <sup>+</sup>	8,76 (с, 2H), 8,36 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,61-7,50 (м, 2H), 7,42-7,31 (м, 2H)
8		не зовсім біла тверда речовина	222,5-224,6	ESIMS m/z 284 [M+H] <sup>+</sup>	8,64 (с, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,32 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,64 (д, J=7,9 Гц, 1H), 7,56-7,31 (м, 3H)



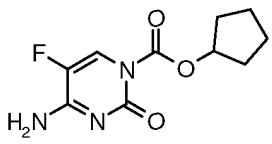
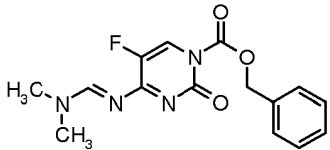
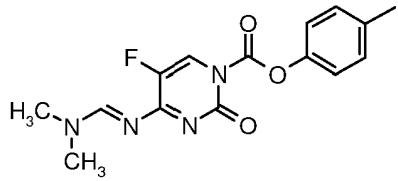
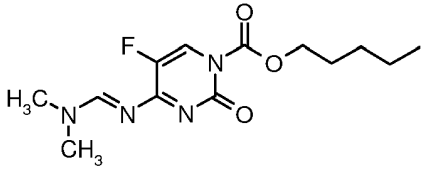
Продовження таблиці I

Спол.	Структура	Зовнішній вигляд	Т. пл. (°C)	MS	<sup>1</sup> H-ЯМР (δ, ДМСО-d <sub>6</sub> ), якщо не вказано інше
9		не зовсім біла тверда речовина	156,8-158,2	ESIMS m/z 268 [M+H] <sup>+</sup>	8,71 (с, 1H), 8,61 (с, 1H), 8,33 (д, J=7,3 Гц, 1H), 7,37-7,29 (м, 4H)
10		блідо-жовта тверда речовина	235-237	ESIMS m/z 264 ([M+H] <sup>+</sup> 1,0 %), 128 ([M-COOC <sub>7</sub> H <sub>7</sub> ] <sup>-</sup> 99 %)	8,65 (с, 1H), 8,52 (с, 1H), 8,30 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,26 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,22-7,12 (м, 2H), 2,32 (с, 3H)
11		біла тверда речовина	145,8-146,8	ESIMS m/z 298 [M+H] <sup>+</sup>	8,52 (с, 1H), 8,32 (с, 1H), 8,10 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,70 (дд, J=5,4, 3,9 Гц, 1H), 7,52 (дд, J=5,6, 3,6 Гц, 1H), 7,41 (дд, J=5,4, 3,9 Гц, 2H), 5,42 (с, 2H)
12		не зовсім біла тверда речовина	142,8-145,1	ESIMS m/z 308 [M+H] <sup>+</sup>	8,63 (с, 1H), 8,36 (с, 1H), 7,95 (д, J=6,0 Гц, 1H), 7,43-7,24 (м, 5H), 4,52 (с, 2H), 4,25-4,23 (м, 2H), 3,69-3,62 (м, 2H)
13		не зовсім біла тверда речовина	240-243	ESIMS m/z 188 ([M+H] <sup>+</sup> 6,0 %), 128 ([M-COOCH <sub>3</sub> ] <sup>-</sup> 94 %)	8,60 (с, 1H), 8,54 (с, 1H), 8,14 (д, J=7,2 Гц, 1H), 3,86 (с, 3H)
14		не зовсім біла тверда речовина	145,1-146,3	ESIMS m/z 248 [M+H] <sup>+</sup>	8,93 (с, 2H), 8,25 (д, J=7,1 Гц, 1H), 4,39 (т, J=5,9 Гц, 2H), 3,79 (т, J=6,5 Гц, 2H), 2,21-2,06 (м, 2H)

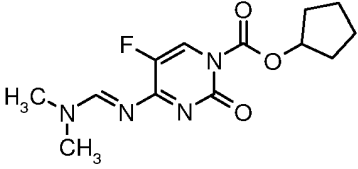
Продовження таблиці I

Спол.	Структура	Зовнішній вигляд	Т. пл. (°C)	MS	<sup>1</sup> H-ЯМР (δ, ДМСО-d <sub>6</sub> ), якщо не вказано інше
15		не зовсім біла тверда речовина	94,2-96,3	ESIMS m/z 231 ([M-H] <sup>-</sup> , 18 %), 128 ([M-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> ] <sup>-</sup> , 61 %)	8,58 (с, 1H), 8,48 (с, 1H), 8,11 (д, J=7,1 Гц, 1H), 4,45-4,33 (м, 2H), 3,70-3,56 (м, 2H), 3,29 (с, 3H)
16		не зовсім біла тверда речовина	219,3-221,1	ESIMS m/z 304 ([M+H] <sup>+</sup> , 0,24 %), 128 ([M-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub> ] <sup>-</sup> , 99,28 %)	8,53 (с, 1H), 8,27 (с, 1H), 8,00 (д, J=7,1 Гц, 1H), 5,09 (с, 2H)
17		не зовсім біла тверда речовина	258-260,4	ESIMS m/z 214 [M+H] <sup>+</sup>	9,38 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 8,14 (д, J=6,0 Гц, 1H), 6,06-5,80 (м, 1H), 5,39-5,32 (м, 1H), 5,26-5,20 (м, 1H), 4,62-4,57 (м, 2H)
18		не зовсім біла тверда речовина	165,8-168,1	ESIMS m/z 300 [M+H] <sup>+</sup>	8,62 (с, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,36 (д, J=7,2 Гц, 1H), 8,10-7,93 (м, 3H), 7,87 (д, J=2,0 Гц, 1H), 7,65-7,53 (м, 2H), 7,49 (дд, J=8,9, 2,3 Гц, 1H)
19		не зовсім біла тверда речовина	125,9-128,2	ESIMS m/z 244 [M+H] <sup>+</sup>	9,51 (с, 1H), 9,22 (с, 1H), 8,34 (д, J=7,1 Гц, 1H), 4,30 (т, J=6,5 Гц, 2H), 1,72-1,60 (м, 2H), 1,44-1,21 (м, 4H), 0,88 (т, J=7,0 Гц, 3H)

Продовження таблиці I

Спол.	Структура	Зовнішній вигляд	Т. пл. (°C)	MS	<sup>1</sup> H-ЯМР (δ, ДМСО-d <sub>6</sub> ), якщо не вказано інше
20		біла тверда речовина	139,8-140,6	ESIMS m/z 242 [M+H] <sup>+</sup>	8,94 (с, 2H), 8,29-8,10 (м, 1H), 5,25-5,20 (м, 1H) 2,04-1,32 (м, 8H)
23		не зовсім біла тверда речовина	123,2-124,3	ESIMS m/z 319 [M+H] <sup>+</sup>	(ацетон-d <sub>6</sub> ) 8,65 (с, 1H), 8,22 (д, J=2,6 Гц, 1H), 7,49 (д, J=6,5 Гц, 2H), 7,46-7,35 (м, 3H), 5,30 (с, 2H), 3,30 (с, 3H), 3,18 (с, 3H)
24		не зовсім біла тверда речовина	179-181,2	ESIMS m/z 319 [M+H] <sup>+</sup>	(метанол-d <sub>4</sub> ) 8,74 (с, 1H), 8,24 (д, J=2,8 Гц, 1H), 7,24 (д, J=8,3 Гц, 2H), 7,14 (д, J=8,6 Гц, 2H), 3,25 (с, 3H), 3,20 (с, 3H), 2,35 (с, 3H)
25		смоло-подібна речовина		ESIMS m/z 299 [M+H] <sup>+</sup>	(CDCl <sub>3</sub> ) 8,66 (с, 1H), 8,18 (д, J=2,4 Гц, 1H), 4,26 (т, J=6,7 Гц, 2H), 3,22 (с, 3H), 3,20 (с, 2H), 1,85-1,67 (м, 2H), 1,45-1,28 (м, 4H), 0,91 (дд, J=9,0, 4,4 Гц, 3H)

Продовження таблиці I

Спол.	Структура	Зовнішній вигляд	Т. пл. (°C)	MS	<sup>1</sup> H-ЯМР (δ, ДМСО-d <sub>6</sub> ), якщо не вказано інше
26		не зовсім біла тверда речовина	103,5-104,6	ESIMS m/z 297 [M+H] <sup>+</sup>	(CDCl <sub>3</sub> ) 8,70 (с, 1H), 8,26 (д, J=2,2 Гц, 1H), 5,25-5,18 (м, 1H), 3,37 (с, 3H), 3,28 (с, 3H), 1,95-1,85 (м, 4H), 1,84-1,72 (м, 2H), 1,70-1,59 (м, 2H)

## Приклад 8

Оцінка фунгіцидної активності: септоріоз листя пшениці (*Mycosphaerella graminicola*; анаморфа: *Septoria tritici*; Bayer code SEPTTR)

Рослини пшениці (сорт Yuma) вирощували із зерен в теплиці, в 50 % мінеральної 5 грунту/50 % безґрунтової суміші Metro, до появи повністю першого листка, з використанням 7-10 сіянців на горщик. Ці рослини інокулювали за допомогою водної суспензії спор *Septoria tritici* або до, або після обробок фунгіцидом. Після інокуляції рослини утримували при 100 %-вій відносній 10 вологості (один день в темному вологому приміщенні, потім дві-три дні в освітленому вологому приміщенні), дозволяючи спорам проростати і інфікувати лист. Рослини потім переносили в теплицю для розвитку захворювання.

У наступній таблиці представлена активність типових сполук згідно з даним винаходом, які оцінювали в цих експериментах. Ефективність тестованих сполук відносно захворювання, з 15 яким треба боротися, визначали шляхом оцінки тяжкості захворювання у разі оброблених рослин, потім переведення тяжкості захворювання в процентах від контролю, що базується на рівні захворювання у разі необроблених інокульованих рослин.

У кожному випадку таблиці I, оцінна шкала представлена як йде нижче:

% Контролю захворювання	Оцінка
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
не тестовано	E

20

ТАБЛИЦЯ I

Активність сполук (один день відносно захисту (1DP) і три дні відносно лікування (3DC)) у випадку SEPTTR, при 100 ч/млн.

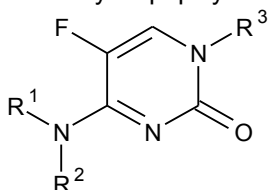
Сполука	SEPTTR 100 ч./млн. 1DP	SEPTTR 100 ч./млн. 3DC
1	A	A
2	A	A
3	A	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A

Продовження ТАБЛИЦІ I

Сполука	SEPTTR 100 ч./млн. 1DP	SEPTTR 100 ч./млн. 3DC
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	A	A
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	A	A
22	E	E
23	E	E
24	E	E
25	E	E
26	E	E

## ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука формули I:

де R<sup>1</sup> означає:

H;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково заміщений 1-3 R<sup>4</sup>;10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, необов'язково заміщений 1-3 R<sup>4</sup>;C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкініл, необов'язково заміщений 1-3 R<sup>4</sup>;феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>

або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна

15 містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 R<sup>5</sup>;-(CHR<sup>6</sup>)<sub>m</sub>OR<sup>7</sup>;-C(=O)R<sup>8</sup>;-C(=S)R<sup>8</sup>;20 -S(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup>;-C(=O)OR<sup>8</sup>;-C(=S)OR<sup>8</sup>;-(CHR<sup>6</sup>)<sub>m</sub>N(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup>;-C(=O)N(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup>; або25 -C(=S)N(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup>;

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

R<sup>2</sup> означає H або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково заміщений R<sup>4</sup>;альтернативно, R<sup>1</sup> і R<sup>2</sup>, взяті разом, можуть утворювати =CR<sup>11</sup>N(R<sup>12</sup>)R<sup>13</sup>;R<sup>3</sup> означає -C(=O)OR<sup>8</sup> або -C(=S)OR<sup>8</sup>;

$R^4$  незалежно означає 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,  $C_1$ - $C_4$ -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,

5  $R^5$  незалежно означає 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, 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, галогентіо;

10  $R^6$  означає Н,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3  $R^5$ ;

$R^7$  означає Н,  $C_1$ - $C_6$ -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 може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

15  $R^8$  означає Н,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкеніл,  $C_3$ - $C_6$ -алкініл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл, -  $(CH_2)_2OCH_2(C_6H_5)$ , феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

20  $R^9$  означає Н,  $C_1$ - $C_6$ -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 може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

25  $R^{10}$  означає Н,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксіалкіл,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, бензил, де бензил може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ ;

альтернативно,  $R^9$  і  $R^{10}$ , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ ;

$R^{11}$  означає Н або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл;

35  $R^{12}$  означає Н, 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 може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ;

40 альтернативно,  $R^{11}$  і  $R^{12}$ , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ ;

45  $R^{13}$  означає Н,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_2$ - $C_6$ -алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний з фенілу або бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або 5-6 конденсованою циклічною системою, або 6-6 конденсованою циклічною системою, де кожна містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3  $R^5$ ; і

альтернативно,  $R^{12}$  і  $R^{13}$ , взяті разом, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$ .

50 2. Композиція для боротьби з грибковим хвороботворним мікроорганізмом, яка містить сполуку за п. 1 і ботанічно прийнятний носій.

3. Композиція за п. 2, де грибковим хвороботворним мікроорганізмом є парша яблук (*Venturia inaequalis*), септоріоз листя пшениці (*Septoria tritici*), церкоспороз цукрового буряка (*Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і чорна гнилизна у разі бананів (*Mycosphaerella fijiensis*).

55 4. Спосіб боротьби і запобігання грибковій атаці відносно рослини, при якому проводять стадії: нанесення фунгіцидно ефективною кількості щонайменше однієї зі сполук за п. 1 на щонайменше одну рослину, на площу, яка прилягає до рослини, ґрунт, адаптований для сприяння зростанню рослини, корінь рослини, листя рослини і насіннєвий матеріал, адаптований до утворення рослини.

---

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

---

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

---

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