



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **106764** (13) **C2**  
(51) МПК (2014.01)  
**C07D 339/00**

## (12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	<b>а 2012 02729</b>	(72) Винахідник(и):	<b>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)</b>
(22) Дата подання заявки:	<b>05.08.2010</b>	(73) Власник(и):	<b>ДАУ АГРОСАЙЕНСІЗ ЕЛЕЛСІ, 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268- 1054, United States of America (US)</b>
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	<b>10.10.2014</b>	(74) Представник:	<b>Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115</b>
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>61/232,204</b>	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	<b>EP 0877022 (A1), 11.11.1998 US 3368938 (A), 13.02.1968 US 2003039667 (A1), 27.02.2003 WO 2009094442 (A2), 30.07.2009</b>
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	<b>07.08.2009</b>		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	<b>US</b>		
(41) Публікація відомостей про заявку:	<b>11.06.2012, Бюл.№ 11</b>		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	<b>10.10.2014, Бюл.№ 19</b>		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	<b>PCT/US2010/044592, 05.08.2010</b>		

## (54) ПОХІДНІ N1-СУЛЬФОНІЛ-5-ФТОРПІРИМІДИНОНУ

### (57) Реферат:

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

UA 106764 C2



Опис

Посилання на споріднені заявки

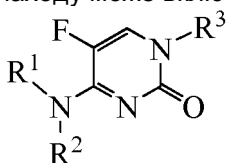
По даній заявці заявляється пріоритет по попередній патентній заявці США № 61232204, поданій 7 серпня 2009 року.

Рівень техніки і суть винаходу

Фунгіциди являють собою сполуки, природного або синтетичного походження, які мають захисну і/або лікувальну дію на рослини проти уражень, викликаних грибами-паразитами сільськогосподарських культур. Як правило, не існує виключно фунгіциду, який був би корисним у всіх ситуаціях. Отже, продовжується дослідження з метою отримання фунгіцидів, які можуть мати кращі характеристики, бути більш зручними при нанесенні і менше коштувати.

Даний винахід стосується N1-сульфоніл-5-фторпіримідинонових сполук і їх застосування як фунгіцидів. Сполуки даного винаходу можуть забезпечувати захист від аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтероміцетів і ооміцетів.

Один варіант здійснення даного винаходу може включати сполуки формули I:



Формула I,

де R<sup>1</sup> являє собою:

H;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений 1-3 R<sup>4</sup>;

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 кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне з кілець може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 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>;

-C(=O)OR<sup>8</sup>;

-C(=S)OR<sup>8</sup>;

-S(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup>;

-(CHR<sup>6</sup>)<sub>m</sub>N(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup>;

-C(=O)<sub>n</sub>(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup> або

-C(=S)<sub>n</sub>(R<sup>9</sup>)R<sup>10</sup>;

де m дорівнює цілому числу 1-3;

R<sup>2</sup> являє собою:

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> можуть бути взятими разом, з утворенням =CR<sup>11</sup>N(R<sup>12</sup>)R<sup>13</sup>;

R<sup>3</sup> являє собою -S(O)<sub>2</sub>R<sup>14</sup>;

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

R<sup>5</sup> незалежно являє собою галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>діалкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкілсульфоніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціаногрупу;

R<sup>6</sup> являє собою H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, феніл або бензил, де кожний бензил або феніл може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

R<sup>7</sup> являє собою H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкініл, 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup> або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою

системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;

5 R<sup>8</sup> являє собою H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup> або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;

10 R<sup>9</sup> являє собою 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup> або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;

15 R<sup>10</sup> являє собою 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 або бензил, де бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

альтернативно, R<sup>9</sup> і R<sup>10</sup> можуть бути взятими разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>;

20 R<sup>11</sup> являє собою H або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл

R<sup>12</sup> являє собою H, ціаногрупу, 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

25 альтернативно, R<sup>11</sup> і R<sup>12</sup> можуть бути взятими разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>;

R<sup>13</sup> являє собою 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;

30 альтернативно, R<sup>12</sup> і R<sup>13</sup> можуть бути взятими разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>; і

R<sup>14</sup> являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>діалкіламіно, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, 4-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-ілокси)-3-метилфенілом, 4-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-ілокси)-2-метилфенілом або 5- або 6-членим насиченим або ненасиченим кільцем, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>.

Інший варіант здійснення даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для боротьби або запобігання ураженню грибами, яка містить сполуки, описані нижче, і фітологічно прийнятну речовину-носії.

40 Ще один варіант здійснення даного винаходу може включати спосіб боротьби або запобігання ураженню рослин грибами, що включає стадії нанесення фунгіцидно ефективною кількості однієї або більше сполук, описаних нижче, щонайменше, на один з грибків, на рослини, на ділянку навколо рослини, на посівний матеріал даної рослини.

45 Термін "алкіл" стосується розгалуженого, нерозгалуженого або циклічного вуглецевого ланцюга, включаючи метил, етил, пропіл, бутіл, ізопропіл, ізобутіл, трет-бутіл, пентил, гексил, циклопропіл, циклобутіл, циклопентил, циклогексил і тому подібне.

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

50 Термін "алкініл" стосується розгалуженого або нерозгалуженого вуглецевого ланцюга, що містить один або більше потрійних зв'язків, включаючи пропініл, бутиніл і тому подібне.

Використовуваний в даному описі 'R' стосується групи, що складається з C<sub>2-6</sub>алкілу, C<sub>3-6</sub>алкенілу або C<sub>3-6</sub>алкінілу, якщо не вказане інше.

Термін "алкокси" стосується замісника -OR.

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

55 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 будь-якою їх комбінацією.

Термін "алкілтіо" стосується замісника -S-R.

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

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

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

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

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

Термін "триалкілсиліл" стосується  $-SiR_3$ .

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

Термін "гідроксил" стосується замісника  $-OH$ .

10 Термін "аміногрупа" стосується замісника  $-NH_2$ .

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.

Термін "алкоксіалкіл" стосується алкоксизаміщення на алкілі.

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

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

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

20 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.

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

Термін "галоген" або "галогено" стосується одного або більше атомів галогену, визначених як F, Cl, Br і I.

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

Термін "нітро" стосується замісника  $-NO_2$ .

30 Термін "арил" стосується циклічного, ароматичного замісника, що складається з водню і вуглецю.

У рамках даного винаходу вважається, що посилання на сполуки формули I також включає оптичні ізомери і солі формули 1, і їх гідрати. Як правило, якщо формула I містить алкільну групу з розгалуженим ланцюгом, то потрібно розуміти, що дані сполуки включають їх оптичні ізомери і рацемати. Конкретні солі включають: гідрохлорид, гідробромід, гідройодид і тому подібне. Крім того, сполуки формули 1 можуть включати таутомерні форми.

Деякі сполуки, розкриті в даному описі, можуть існувати у вигляді одного або більше ізомерів. Фахівцям в даній галузі техніки буде очевидно, що один ізомер може бути більш активним, ніж інші. Структури, розкриті в даному розкритті, зображені тільки в одній геометричній формі для ясності, але мається на увазі, що вони являють собою всі геометричні і таутомерні форми даної молекули.

Також, фахівцям в даній галузі техніки буде зрозуміло, що допустиме додаткове заміщення, якщо не вказане інше, за умови, що дотримуються правила утворення хімічного зв'язку і енергії напруження, і продукт все ще виявляє фунгіцидну активність.

45 Інший варіант здійснення даного винаходу являє собою застосування сполуки формули 1 для захисту рослин від уражень фітопатогенними мікроорганізмами або для лікування рослин, заражених фітопатогенними мікроорганізмами, що включає застосування сполуки формули I або композиції, що містить дану сполуку, для обробки ґрунту, рослини, ділянки рослини, листя і/або насіння.

50 Крім того, інший варіант здійснення даного винаходу являє собою композицію, що застосовується для захисту рослини від уражень фітопатогенними мікроорганізмами і/або лікування рослини, зараженої фітопатогенними мікроорганізмами, що містить сполуку формули I і фітологічно прийнятну речовину-носію.

55 Додаткові характеристики і переваги даного винаходу стануть очевидними для фахівців в даній галузі техніки при розгляді приведенного нижче докладного опису ілюстративних варіантів здійснення, що служать прикладом кращого способу здійснення даного винаходу, як розуміється в цей час.

Докладний опис винаходу

60 Сполуки даного винаходу можуть наноситися за будь-якою з різноманітних відомих методик, або у вигляді сполуки, або у вигляді препаратів, що містять дані сполуки. Наприклад, дані

сполуки можна наносити на коріння, насіння або листя рослин для боротьби з різними грибами, не зменшуючи комерційної цінності рослин. Дані речовини можна наносити в формі будь-якого зі звичайно використовуваних типів препаратів, наприклад, в формі розчинів, дустів, змочуваних порошків, рідких концентратів або емульгованих концентратів.

5 Переважно, сполуки даного винаходу наносять в формі препарату, що містить одну або більше сполук формули I і фітологічно прийнятний носій. Концентровані препарати для нанесення можуть бути дисперговані у воді або інших рідинах, або препарати можуть бути пилоподібними або гранульованими, і тоді їх можна наносити без додаткової обробки. Дані препарати можна отримати по загальноприйнятих в агрохімії методиках.

10 Даний винахід передбачає всі середовища, за допомогою яких можна приготувати препарати з однієї або більше описаних сполук для доставки і застосування як фунгіциду. Звичайно препарати наносять у вигляді водних суспензій або емульсій. Подібні суспензії або емульсії можна отримати з водорозчинних, суспендованих у воді або емульгованих препаратів, які являють собою тверді речовини, звичайно відомі як змочувані порошки; або рідини, звичайно відомі як емульговані концентрати, водні суспензії або концентрати суспензії. Як буде неважко зрозуміти, можна бути використана будь-яка речовина, до якої можна додавати дані сполуки, за умови, що це приносить бажану користь без значного зменшення активності даних сполук як противогрибкових агентів.

20 Змочувані порошки, які можуть бути спресовані з утворенням диспергованих у воді гранул, містять гомогенну суміш однієї або більше сполук формули I, інертного носія і поверхнево-активних речовин. Концентрація сполуки в змочуваному порошку може складати від близько 10 процентів до близько 90 процентів по масі відносно загальної маси змочуваного порошку, більш переважно від близько 25 масових процентів до близько 75 масових процентів. При отриманні препаратів змочуваного порошку, сполуки можуть бути змішані з будь-якою дрібнодисперсною твердою речовиною, такою як профіліт, тальк, крейда, гіпс, фулерова земля, бентоніт, атапульгіт, крохмаль, казеїн, глютен, монтморилонітові глини, діатомові землі, очищені силікати або тому подібне. У подібних способах отримання дрібнодисперсний носій і поверхнево-активні речовини звичайно змішують із сполукою(ами) і подрібнюють.

30 Емульговані концентрати сполук формули I можуть містити відповідну концентрацію, таку як від близько 10 масових процентів до близько 50 масових процентів, даної сполуки у відповідній рідині, відносно загальної маси даного концентрату. Дані сполуки можуть бути розчинені в інертному носії, який являє собою або змішуваний з водою розчинник, або суміш незмішуваних з водою органічних розчинників і емульгаторів. Концентрати можна розбавляти водою або маслом, з отриманням сумішей для обприскування у вигляді емульсії типу масло у воді. Використовувані органічні розчинники включають ароматичні, особливо нафталінові і олефінові фракції нафти з високою температурою кипіння, такі як важка ароматична нафта. Також можна використовувати інші органічні розчинники, наприклад, терпенові розчинники, включаючи похідні каніфолі, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон, і заміщені спирти, такі як 2-етоксіетанол.

40 Емульгатори, які можуть переважно використовуватися в цьому випадку, можуть бути легко визначені фахівцями в даній галузі техніки і включають різні неіонні, аніонні, катіонні і амфотерні емульгатори або суміш двох або більше емульгаторів. Приклади неіонних емульгаторів, що використовуються для отримання емульгованих концентратів, включають поліалкіленгліколеві ефіри і продукти конденсації алкіл- і арилфенолів, аліфатичних спиртів, аліфатичних амінів або жирних кислот з етиленоксидом, пропіленоксидами, такими як етоксировані алкілфеноли, і ефір карбонових кислот, солюбілізовані в поліолі або поліоксіалкілені. Катіонні емульгатори включають сполуки четвертинного амонію і солі жирних амінів. Аніонні емульгатори включають розчинні в маслі солі (наприклад, кальцієві) алкіларилсульфонових кислот, розчинні в маслі солі або сульфатовані полігліколеві ефіри і відповідні солі фосфатованого полігліколевого ефіру.

50 Репрезентативними органічними рідинами, які можна використовувати для отримання емульгованих концентратів сполук даного винаходу, є ароматичні рідини, такі як ксилол, пропілбензолові фракції; або змішані нафталінові фракції, мінеральні масла, заміщені ароматичні органічні рідини, такі як діоктилфталат; гас; діалкіламіді різних жирних кислот, особливо диметиламіді жирних гліколів і гліколевих похідних, таких як н-бутиловий ефір, етиловий ефір або метиловий ефір діетиленгліколю, і метиловий ефір триетиленгліколю і тому подібне. Для отримання емульгованого концентрату також можна використовувати суміші двох або більш органічних рідин. Органічні рідини включають ксилол і пропілбензолові фракції, при цьому ксилол є більш переважним в деяких випадках. У рідких препаратах звичайно застосовуються поверхнево-активні диспергуючі агенти в кількості від 0,1 до 20 процентів по масі відносно сукупної маси диспергуючого агента і однієї або більше зі сполук винаходу.

Препарати можуть також містити інші сумісні добавки, наприклад, регулятори росту рослин і інші біологічно активні сполуки, які застосовуються в сільському господарстві.

Водні суспензії містять суспензії однієї або більше нерозчинних у воді сполук формули I, диспергованих у водному середовищі в концентрації в діапазоні від близько 5 до близько 50 масових процентів відносно загальної маси водної суспензії. Суспензії отримують тонким подрібненням однієї або більше сполук винаходу і інтенсивним перемішуванням основної речовини в якому-небудь середовищі, що містить воду і поверхнево-активні речовини, вибрані з таких типів, які обговорювалися вище. Можна також додавати інші компоненти, такі як неорганічні солі і синтетичні і природні камеді, з метою збільшення густини і в'язкості водного середовища. Часто більш ефективним є одночасне подрібнення і змішування, з отриманням, при цьому, водної суміші і гомогенізацією її за допомогою такого пристрою, як піщаний млин, кульовий млин або гомогенізатора поршневого типу.

Водні емульсії включають емульсії одного або більше нерозчинних у воді інгредієнтів, з пестицидною активністю, емульгованих у водному середовищі звичайно в концентрації в діапазоні від близько 5 до близько 50 масових процентів відносно загальної маси водної емульсії. Якщо інгредієнт з пестицидною активністю являє собою тверду речовину, то перед отриманням водної емульсії він повинен бути розчинений у відповідному незмішуваному з водою розчиннику. Емульсії отримують емульгуванням рідкого інгредієнта з пестицидною активністю або його незмішуваного з водою розчину у водному середовищі звичайно з включенням поверхнево-активних речовин, які полегшують утворення і стабілізацію емульсії, описаної вище. Даний процес часто проводять за допомогою інтенсивного перемішування, здійснюваного мішалками з великими зсувними зусиллями або гомогенізаторами.

Сполуки формули I також можна застосовувати у вигляді гранульованих препаратів, які, зокрема, застосовуються для обробки ґрунту. Гранульовані препарати звичайно містять від близько 0,5 до близько 10 масових процентів, відносно загальної маси гранульованого препарату, сполуки(сполук), диспергованої в інертному носії, який складається повністю або здебільшого з грубо подрібненої інертної речовини, такої як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або подібна недорога речовина. Подібні препарати звичайно отримують розчиненням сполук винаходу у відповідному розчиннику і нанесенням їх на гранульований носій, який заздалегідь був відформований до відповідного розміру частинок, в діапазоні від близько 0,5 до близько 3 мм. Відповідний розчинник являє собою розчинник, в якому сполука даного винаходу суттєво або повністю розчиняється. Подібні препарати також можна отримувати приготуванням густої маси або пасти з носія і сполуки і розчинника, і подрібненням і сушінням до отримання бажаних гранульованих частинок.

Дусти, що містять сполуки формули I, можна отримувати ретельним перемішуванням однієї або більше сполук винаходу у вигляді порошку з відповідним пилоподібним сільськогосподарським носієм, таким як, наприклад, каолінова глина, подрібнена вулканічна порода і тому подібне. Дусти можуть відповідно містити від близько 1 до близько 10 масових процентів сполуки винаходу відносно загальної маси дусту.

Препарати можуть додатково містити ад'юванти поверхнево-активних речовин для полегшення нанесення, змочування і проникнення сполуки в цільову сільськогосподарську культуру або мікроорганізм. Дані ад'юванти поверхнево-активних речовин можуть необов'язково застосовуватися як компонент препарат або як суміш резервуара. Кількість ад'юванта поверхнево-активних речовин звичайно варіюється від 0,01 до 1,0 процента по об'єму відносно розпилюваного об'єму води, переважно від 0,05 до 0,5 об'ємного процента. Відповідні ад'юванти поверхнево-активних речовин включають, але не обмежуються ними, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або природні спирти, солі складних ефірів або сульфоянтарних кислот, етоксировані органосилікони, етоксировані жирні аміни і суміші даних поверхнево-активних речовин з мінеральними маслами або рослинними оліями. Препарати можуть також включати емульсії типу масло у воді, такі як емульсії, описані в патентній заявці США № 11/495228, опис якої спеціально включений в даний опис за допомогою посилання.

Препарати можуть необов'язково включати комбінації, які містять інші пестицидні сполуки. Подібні додаткові пестицидні сполуки можуть являти собою фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематодциди, майтициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які є сумісними зі сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для застосування, і не є антагоністами активності сполуки даного винаходу. Відповідно, в подібних варіантах здійснення інше пестицидна сполука застосовується як додаткова токсична речовина для одного і того ж або для іншого пестицидного застосування. Сполуки формули 1 і пестицидна сполука в даній комбінації звичайно можуть бути представлені в масовому співвідношенні від 1:100 до 100:1.

Сполуки даного винаходу також можна комбінувати з іншими фунгіцидами для отримання їх фунгіцидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки даного винаходу часто наносять спільно з одним або більше іншими фунгіцидами для боротьби з більш широкою різноманітністю небажаних захворювань. При використанні в сукупності з іншим фунгіцидом(ами) сполуки даного винаходу можуть бути сформульовані в один препарат з іншим фунгіцидом(ами), змішані з іншим фунгіцидом(ами) в резервуарі або можуть наноситися послідовно з іншим фунгіцидом(ами). Такі інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатометилтіо)бензотіазол, 2-фенілфенол, сульфат 8-гідроксигіноліну, аметоктрадин, амисульбром, антимицин, *Ampelomyces quisqualis*, азаконазол, азоксистробін, *Bacillus subtilis*, *Bacillus subtilis* штам QST713, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб-ізопропіл, бензиламінобензол-сульфонатна (BABS) сіль, бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, диксафен, бластицидин-S, буру, бордоську рідину, боскалід, бромуконазол, 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, дихлорофен, диклоцимет, дипломезин, дихлоран, діетофенкарб, дифеноконазол, дифензокват іон, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон, додеморф, додеморф ацетат, додин, вільна основа додину, едифенфос, енестробін, епоксиконазол, етабоксам, етоксигін, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентин ацетат, фентин гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, фторимід, флуоксастробін, флухіноконазол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, формальдегід, фосетил, фосетил алюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гуазатин, гуазатин ацетати, GY-81, гексахлоробензол, гексаконазол, гимексазол, імазаліл, імазаліл сульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадин триацетат, іміноктадин тріс(альбесилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, ламінарин, касугаміцин, касугаміцин гідрохлорид гідрат, крезоксим-метил, манкопер, манкоцеб, мандипропамід, манеб, мепаніпірим, мепроніл, хлорид двовалентної ртуті, оксид ртуті, хлорид ртуті, металаксил, мефеноксам, мептилдинокап, металаксил-М, метам, метам амоній, метам калій, метам натрій, метконазол, метасульфоккарб, метилйодид, метилізоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мільдіоміцин, міклобутаніл, набам, нітротал-ізопропіл, нуаримол, октилінон, офуреїс, олеїнову кислоту (жирні кислоти), оризастробін, оксаксиксил, оксин-копер, окспоконазол фумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат, пентіопірад, ацетат фенілртуті, фосфонову кислоту, фталід, піоксистробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, гідроксигінолінсульфат калію, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, прохіназид, протіоконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піриофенон, пірохілон, хінокламін, хінофен, хінтозен, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, седаксан, силтіофам, симеконазол, 2-фенілфеноксид натрію, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірку, SYP-Z071, SYP-Z048, кам'яновугільні масла, тебуконазол, тебуфлорин, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін, зинеб, зирам, зоксамід, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, препарати *Gliocladium*, *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, препарати *Trichoderma*, (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл)-2-(метоксиметил)сукцинімід, 1,2-дихлорпропан, гідрат 1,3-дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетону, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитіін-1,1,4,4-тетраоксид, ацетат 2-метоксіетилртуті, хлорид 2-метоксіетилртуті, силікат 2-метоксіетилртуті, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)фенілтіоціанатем, ампропілфос, анілазин, азитірам, полісульфід барію, Bayer 32394, беноданіл, бенхінокс, бенталурон, бензамакрил; бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бінапакрил, сульфат біс(метилртуті), біс(трибутилтин)оксид, бутіобат, кадмій-кальцій-мідь-цинк-хромат-сульфатфат, карбаморф, СЕСА, хлорбензіазол, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорхінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол, ципрофурам, декафентин, дихлон, дихлоролін, диклобутразол, диметиримол, диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритіон, диталімфос,



додицин, дразоксолон, ЕВР, ЕSBP, етаконазол, етем, етирим, фенаміносульф, фенапаніл, фенітропан, 5-фторцитозин і їх профунгіциди, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофульвін, галакринат, Hercules 3944, гексилтіофос, ICIA0858, ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксолон, метфуроксам, диціандіамід метилртуті, метсульфовакс, мілнеб, ангідрид мукохлористої кислоти, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилмеркуріо-4-толуолсульфонанілід, нікель біс(диметилдитіокарбамат), OCH, диметилдитіокарбамат фенілртуті, нітрат фенілртуті, фосдифен, піколінамід UK-2A і їх похідні, протіокарб; протіокарб гідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксихлор, піроксифур, хінацетол; сульфат хінацетолу, хіназамід, хінконазол, рабензазол, саліциланілід, SSF-109, султропен, текорам, тіадифлуор, тиціофен, тіохлорфенфім, тіофанат, тіохінокс, тіоксимід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихламід, урбацід і зариламід і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки даного винаходу можна комбінувати з іншими пестицидами, включаючи інсектициди, нематодициди, майтициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які є сумісними із сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для нанесення, і не пригнічують активність даних сполук, з утворенням їх пестицидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки даного винаходу можуть наноситися в сукупності з одним або більше іншими пестицидами для боротьби з більш широкою різноманітністю небажаних сільськогосподарських шкідників. При використанні в сукупності з іншими пестицидами сполуки даного винаходу можуть бути сформульовані в один препарат з іншим пестицидом(ами), змішані з іншим пестицидом(ами) в резервуарі або можуть наноситися послідовно з іншим пестицидом(ами). Звичайні інсектициди включають, але не обмежуються ними: антибіотичні інсектициди, такі як алосамідин і турингінзін; інсектициди групи макроциклічних лактонів, такі як спіносад і спінеторам; авермектинові інсектициди, такі як абамектин, дорамектин, емаектин, еприномектин, івермектин і селамектин; мілбеміцинові інсектициди, такі як лепімектин, мілбемектин, мілбеміцин оксим і моксидектин; миш'якові інсектициди, такі як арсенат кальцію, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, арсенат свинцю, арсеніт калію і арсеніт натрію; рослинні інсектициди, такі як анабазин, азадирактин, 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, карбосульфат, декарбофуран і фуратіокарб; диметилкарбаматні інсектициди, такі як димітан, диметилан, гішінкарб і піримікарб; оксимкарбаматні інсектициди, такі як аланікарб, альдікарб, альдоксикарб, бутоксикарб, бутоксикарб, метоміл, нітрилакарб, оксаміл, тазимкарб, тіокарб, тіодикарб і тіофанокс; фенілметилкарбаматні інсектициди, такі як аліксикарб, амінокарб, буфенкарб, бутакарб, карбанолат, клоетокарб, дикрезил, діоксикарб, ЕМРС, етіофенкарб, фенетакарб, фенобукарб, ізопрокарб, метіокарб, метолкарб, мексакарбат, промацил, промеккарб, пропоскур, триметаккарб, ХМС і ксилікарб; інсектициди десиканти, такі як борна кислота, діатомова земля і силікагель; діамідні інсектициди, такі як хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; динітрофенольні інсектициди, такі як динекс, динопроп, динозам і DNOC; фторвмісні інсектициди, такі як гексафторсилікат барію, кріоліт, фторид натрію, гексафторсилікат натрію і сульфлурамід; формамідинові інсектициди, такі як амітраз, хлордимеформ, форметанат і формпаранат; фумігаційні інсектициди, такі як акрилонітрил, сірковуглець, чотирихлористий вуглець, хлороформ, хлорпікрин, пара-дихлорбензол, 1,2-дихлорпропан, етилформіат, етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, ціаністий водень, йодометан, метилбромід, метилхлороформ, метиленхлорид, 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 бістрифлурон, бупрофезин, хлорфлуазурон, циромазин, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, пенфлурон, тефлубензурон і трифлумурон; імітатори 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 гормону линяння, такі як хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид і тебуфенозид; гормони линяння, такі як  $\alpha$ -екдизон і екдистерон; інгібітори линяння, такі як діофенолан; прекоцени, такі як прекоцен I, прекоцен II і прекоцен III; некласифіковані регулятори розвитку комах, такі як дицикланіл; інсектициди аналога нерейстоксину, такі як бенсультап, картап, тіоциклам і тіосультап; нікотинοїдні інсектициди, такі як флонікамід; нітрогуанідинові інсектициди, такі як клотіанідин, динотефуран, імідаклоприд і тіаметоксам; нітромаєтиленові інсектициди, такі як нітенпірам і нитіазин; піридилметиламінові інсектициди, такі як ацетаміприд, імідаклоприд, нітенпірам і тіаклоприд; органохлорні

інсектициди, такі як бром-DDT, камфехлор, DDT, pp'-DDT, етил-DDD, HCH, гамма-HCH, ліндан, метоксихлор, пентахлорфенол і TDE; циклодієнові інсектициди, такі як альдрин, бромоциклен, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, діелдрин, дилор, ендосульфат, альфа-ендосульфат, ендрин, HEOD, гептахлор, HHDN, ізобензан, ізодрин, келеван і мірекс; органофосфатні інсектициди, такі як бромфенвінфос, хлорфенвінфос, кротоксифос, дихлорвос, дикротофос, диметилвінфос, фоспірат, гептенофос, метокротофос, мевінфос, монокротофос, налед, нафталофос, фосфамідон, пропафос, TEPP і тетрахлорвінфос; органотіофосфатні інсектициди, такі як діоксабензофос, фосметилан і фентоат; аліфатичні органотіофосфатні 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 органотіофосфатні інсектициди, такі як амідітін, ціантоат, диметоат, етоат-метил, формотіон, мекарбам, ометоат, протоат, софамід і вамідотіон; оксиморганотіофосфатні інсектициди, такі як хлорфоксим, фоксим і фоксим-метил; гетероциклічні органотіофосфатні інсектициди, такі як азаметинфос, кумафос, кумітоат, діоксатіон, ендотіон, меназон, морфотіон, фозалон, піраклофос, піридафентіон і хінотіон; бензотіопіранові органотіофосфатні інсектициди, такі як дитіокрофос і тикрофос; бензотриазинові органотіофосфатні інсектициди, такі як азинфос-етил і азинфос-метил; ізоіндольні органотіофосфатні інсектициди, такі як діаліфос і фосмет; ізоксазолові органотіофосфатні інсектициди, такі як ізоксатіон і золапрофос; піразолопіримідинові органотіофосфатні інсектициди, такі як хлорпразофос і піразофос; піридинові органотіофосфатні інсектициди, такі як хлорпірифос і хлорпірифос-метил; піримідинові органотіофосфатні інсектициди, такі як бутатіофос, діазинон, етримфос, ліримфос, піриміфос-етил, піриміфос-метил, примідофос, піримітат і тебупіримфос; хіноксалинові органотіофосфатні інсектициди, такі як хіналфос і хіналфос-метил; тіадіазолові органотіофосфатні інсектициди, такі як атидатіон, літидатіон, метидатіон і протидатіон; триазолові органотіофосфатні інсектициди, такі як ізазофос і триазафос; фенілові органотіофосфатні інсектициди, такі як азотоат, бромфос, бромфос-етил, карбофенотіон, хлортіофос, ціанофос, цитіоат, дикаптон, дихлофентіон, етафос, фамфур, фенхлорфос, фенітротіон, фенсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, гетерофос, йодфенфос, месульфенфос, паратіон, паратіон-метил, фенкаптон, фосніхлор, профенофос, протіофос, сульпрофос, темефос, трихлорметафос-3 і трифенофос; 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 пропетамфос; фосфородіамідні інсектициди, такі як димефокс, мазидокс, міпафокс і скрадан; 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, фіпрол, пірафлупрол, пірипрол і ваніліпрол; інсектициди піретроїдного складного ефіру, такі як акринатрин, алетрин, біоалетрин, бартрин, біфентрин, біоетанометрин, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-ціфлутрин, 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 піретроїдного простого ефіру, такі як етофенпрокс, флуфенпрокс, галфенпрокс, протрифенбут і силафлуофен; піримідинамінові інсектициди, такі як флуфенерим і піримідифен; пірольні інсектициди, такі як хлорфенапір; інсектициди тетрамової кислоти, такі як спіротетрамат; інсектициди тетранової кислоти, такі як спіромезифен; інсектициди похідні тіосечовини, такі як діафентіурон; інсектициди похідні сечовини, такі як флукофурон і сулькофурон; і некласифіковані інсектициди, такі як клозантел, нафтенат міді, кротамитон, EXD, феназафлор, феноксаkrim, гідраметилнон, ізопротіолан, малонобен, метафлумізон, ніфлуридід, пліфенат, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, рафоксанід, сульфоксафлор, триаратен і триазамат і будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки даного винаходу можна комбінувати з гербіцидами, які є сумісними зі сполуками даного винаходу в середовищі, вибраному для нанесення, і не пригнічують активність даних сполук, з утворенням їх пестицидних сумішей і синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки даного винаходу можна використовувати в сукупності з одним або більше гербіцидами для боротьби з широкою різноманітністю небажаних рослин. При використанні в сукупності з гербіцидами сполуки даного винаходу можуть бути сформульовані в один препарат з гербіцидом(ами), змішані з іншим гербіцидом(ами) в резервуарі або наноситися послідовно з гербіцидом(ами). Звичайні гербіциди включають, але не обмежуються ними: амідні гербіциди, такі як алідохлор, бифлутамід, бензадокс, бензипрам, бромобутид, кафенстрол, CDEA, ципразол, диметенамід, диметенамід-Р, диметенамід, епроназ, етніпромід, фентразамід, флупоксам, фомезафен, галозафен, ізокарбамід, ізоксабен, напропамід, напалам, петоксамід, пропізамід, хінонамід і тебутам; анілідні гербіциди, такі як хлоранокрил, цисанілід, кломеппроп, ципромід, дифлуфенікан, етобензанід, феназулам, флуфенацет, флуфенікан, мефенацет, мефлуїдид, метаміфоп, моналід, напроанілід, пентанохлор, піколінафен і пропаніл; арилаланінові гербіциди, такі як бензоілпроп, флампроп і флампроп-М; хлорацетанілідні гербіциди, такі як ацетохлор, алахлор, бутахлор, бутенахлор, делахлор, диетатил, диметахлор, метазлахлор, метолахлор, S-метолахлор, претілахлор, пропахлор, пропізохлор, принахлор, тербухлор, тенілахлор і ксилахлор; сульфонанілідні гербіциди, такі як бензофлуор, перфлуїдон, піримісульфан і профлуазол; сульфонамідні гербіциди, такі як азулам, карбазулам, феназулам і оризалін; тіоамідні гербіциди, такі як хлортіамід; антибіотичні гербіциди, такі як біланафос; гербіциди бензойної кислоти, такі як хлорамбен, дикамба, 2,3,6-TBA і трикамба; гербіциди піримідинілоксibenзойної кислоти, такі як біспірибак і пірмінобак; гербіциди піримідинілтіобензойної кислоти, такі як піритіобак; гербіциди фталевої кислоти, такі як хлортал; гербіциди піколінової кислоти, такі як амінопіралід, клопіралід і піклорам; гербіциди хінолінкарбонової кислоти, такі як хінклорак і хінмерак; миш'якові гербіциди, такі як какодилова кислота, CMA, DSMA, гексафлуорат, МАА, МАМА, MSMA, арсеніт калію і арсеніт натрію; бензоїлциклогександіонові гербіциди, такі як мезотрион, сулькотрион, тефурилтрион і темботрион; бензобуранілалкілсульфонатні гербіциди, такі як бенфуресат і етофумезат; бензотіазолові гербіциди, такі як бензазолін; карбаматні гербіциди, такі як азулам, карбоксазол, хлорпрокарб, дихлормат, феназулам, карбутилат і тербукарб; карбанілатні гербіциди, такі як барбан, ВСПС, карбазулам, карбетамід, СЕРС, хлорбуфам, хлорпрофам, СРРС, десмедифам, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, профам і свеп; циклогексен оксимні гербіциди, такі як алоксидим, бутроксидим, клетодим, клопроксидим, циклоксидим, профоксидим, сетоксидим, тепралоксидим і тралоксидим; циклопропілізоксазолові гербіциди, такі як ізоксахлортол і ізоксафлутол; дикарбоксимідні гербіциди, такі як цинідон-етил, флумезин, флуміклорак, флуміоксазин і флуміпропін; 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, диносеб, динотерб, DNOC, етинофен і мединотерб; гербіциди дифенілового ефіру, такі як етоксифен; гербіциди нітрофенілового ефіру, такі як ацифлуорфен, аклоніфен, біфенокс, хлометоксифен, хлорнітрофен, етніпромід, фтордифен, фторглікофен, фторнітрофен, фомезафен, фурилоксифен, галозафен, лактофен, нітрофен, нітрофлуорфен і оксифлуорфен; дітіокарбаматні гербіциди, такі як дазомет і метам; галогеновані аліфатичні гербіциди, такі як алорак, хлоропон, далапон, флупропанат, гексахлорацетон, йодометан, метилбромід, монохлороцтова кислота, SMA і TCA; імідазолінові гербіциди, такі як імазаметабенз, імазамокс, імазапек, імазапек, імазахін і імазетапек; неорганічні гербіциди, такі як сульфамат амонію, бура, хлорат кальцію, сульфат міді, сульфат заліза, азид калію, ціанат калію, азид натрію, хлорат натрію і сірчана кислота; нітрилові гербіциди, такі як бромбоніл, бромоксиніл, хлороксиніл, дихлобеніл, йодобоніл, йоксиніл і піраклоніл; органофосфорні гербіциди, такі як аміпрофос-метил, анілофос, бенсулід, біланафос, бутаміфос, 2,4-DEP, DMPA, ЕВЕР, фосамін, глуфосинат, глуфосинат-Р, гліфосад і піперофос; фенокисильні гербіциди, такі як бромфеноксим, кломеппроп, 2,4-DEB, 2,4-DEP, дифенопентен, дисул, ербон, етніпромід, фентеракол і трифосим; оксадіазолінові гербіциди, такі як метазол, оксадіаргіл, оксадіазон; оксазолові гербіциди, такі як феноксасульфон; феноксіяцетатні гербіциди, такі як 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-тіоетил і 2,4,5-T; феноксибутиратні 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, ізоксапірифоп, метаміфоп, пропахізафоп, хізалофоп, хізалофоп-Р і трифоп;

фенілєндіамінові гербіциди, такі як динітрамін і продіамін; піразольні гербіциди, такі як піроксасульфєн; бензоїлпіразольні гербіциди, такі як бензофєнап, пірасульфєтол, піразолінал, піразоксифєн і топрамєзон; фєнілпіразольні гербіциди, такі як флуазолат, ніпіраклофєн, піоксаден і пірафлуфєн; піридазинові гербіциди, такі як кредазин, піридафол і піридат;  
 5 піридазинові гербіциди, такі як бромпіразон, хлоридазон, димідазон, флуфєнпїр, метфлуразон, норфлуразон, оксапіразон і пїданон; піридинові гербіциди, такі як амінопїралїд, клїодинат, клопїралїд, дитїопїр, флуороксіпїр, галоксидин, пїклорам, пїколінафєн, пїрїклор, тїазопїр і триклопїр; пїримїдїндіамінові гербіциди, такі як іпрімїдам і трїоклорим; гербіциди похідні четвєртинного амонїю, такі як цїперкват, дієтамкват, дїфєнзєкват, дїкват, морфамкват і  
 10 паракват; тїокарбаматні гербіциди, такі як бутїлат, циклоат, ді-алат, EPTC, єспрокарб, єтієлат, ізополїнат, метїєбенкарб, молїнат, орбенкарб, пєбулат, просульфєкарб, пїрїбутіккарб, сульфалат, тїєбенкарб, тїокарбазил, три-алат і вєрнолат; тїокарбонатні гербіциди, такі як дїмєксано, EXD і проксан; гербіциди похідні тїєсєчєвїнї, такі як метїєурон; тїазинові гербіциди, такі як дїпропетрїн, їндазїфлам, тїазїфлам і трїгїдроксітїазиїн; хлортїазиїнові  
 15 гербіциди, такі як атразїн, хлоразїн, цїаназїн, цїпразїн, єгліназїн, їпазїн, мєзопразїн, процїазїн, прогліназїн, пропазїн, сєбутилазїн, сїмазїн, тєрбутилазїн і тїєїтазїн; метоксітїазиїнові гербіциди, такі як атратон, метомєтон, промєтон, сєкбумєтон, сїмєтон і тєрбумєтон; метїлїтїотїазиїнові гербіциди, такі як амєтрїн, азїпротрїн, цїанатрїн, дєсметрїн, дїметамєтрїн, метопротрїн, промєтрїн, сїмєтрїн і тєрбутрїн; тїазиїнові гербіциди, такі як амєтрїдїєн, амїбузїн, гєксазїєн, їзомєтїєзїн, метамїтрїн і метрїбузїн; тїазолїні гербіциди, такі як амїтрєл, кафєнстрєл, єпрєназ і флупєксам; тїазолєнові гербіциди, такі як амїкарбазон, бєнкарбазон, карфєнтразон, флукарбазон, їпфєнкарбазон, пропєксікарбазон, сульфєнтразон і тїєнкарбазон-мєтїл; тїазолєпїримїдїєнові гербіциди, такі як клорансулам, дїклєсулам, флєрасулам, флумєтсулам, мєтєсулам, пєноксулам і пїроксулам; урацїлїні гербіциди, такі як  
 25 бєнзфєндїзон, бромацил, бутафєнацил, флупропацил, їзєцил, лєнацил, сафлуфєнацил і тєрбацил; гербіциди похідні сєчєвїнї, такі як бєнзтїазурєн, кумїлурєн, циклурєн, дїхлєральсєчєвїна, дїфлуфєнзєпїр, їзонєрурєн, їзєрурєн, мєтабєнзтїазурєн, мєнїзєрурєн і нєрурєн; гербіциди похідні фєнілсєчєвїнї, такі як анїзурєн, бутурєн, хлєрбромурєн, хлєрєтєрурєн, хлєротєлурєн, хлєроксєрурєн, даїмєрурєн, дїфєнєксєрурєн, дїмєфєрурєн, дїєрурєн, фєнєрурєн, флєомєтєрурєн, флєотїєрурєн, їзєпрєтєрурєн, лїнєрурєн, мєтїєрурєн, мєтїлдїмєрурєн, мєтєбєнзєрурєн, мєтєбромєрурєн, мєтоксєрурєн, мєнєлїнєрурєн, мєнєрурєн, пєрафлєрурєн, фєнєбєнзєрурєн, сїдєрурєн, тєтрафлєрурєн і тїдїазєрурєн; гербіциди похідні пїримїдїєнїлсульфєнїлсєчєвїнї, такі як амїдєсульфєрурєн, азїмєсульфєрурєн, бєнєсульфєрурєн, хлєрїмєрурєн, циклєсульфамєрурєн, єтоксієсульфєрурєн, флєазєсульфєрурєн, флєцєтєсульфєрурєн, флєпїрєсульфєрурєн, фєрамєсульфєрурєн, галєсульфєрурєн, їмазєсульфєрурєн, мєзєсульфєрурєн, мєтазєсульфєрурєн, нїкєсульфєрурєн, ортєсульфамєрурєн, оксєсульфєрурєн, пїрїмїєсульфєрурєн, пропїрїєсульфєрурєн, пїразєсульфєрурєн, рїмєсульфєрурєн, сульфємєтєрурєн, сульфєєсульфєрурєн і трїфлєксієсульфєрурєн; гербіциди похідні тїазиїнїлсульфєнїлсєчєвїнї, такі як хлєрєсульфєрурєн, цїнєсульфєрурєн, єтамєтєсульфєрурєн, їдєдєсульфєрурєн, мєтєсульфєрурєн, просульфєрурєн, тїфєнєсульфєрурєн, тїаєсульфєрурєн, тїрїбєнєрурєн, тїрїфлєєсульфєрурєн і тїрїтєєсульфєрурєн; гербіциди похідні тїадїазєлїлсєчєвїнї, такі як бутїєрурєн, єтїдїмєрурєн, тєбутїєрурєн, тїазєфлєрурєн і тїдїазєрурєн; і нєклєсїфікованї гербіциди, такі як акрєлєїн, алїєлєвий спїрт, амїєнєцїклєпїрахлєр, азєфєнїдїєн, бєнтазон, бєнзєбїцїклєн, бїцїклєпїрєн, бутїдазєл, цїанамїд кальцїю, камбєндїхлєр, хлєрфєнак, хлєрфєнпїрєп, хлєрфлєразєл, хлєрфлєрєнєл, цїнмєтїлїєн, клємазон, CPMF, крєзєл, цїанамїд, ортє-дїхлєрбєнзєл, дїмєпїєрєт, єндєтал, фтєрмїдїєн, флєурїдєн, флєрєхлєрїдєн, флєртємон, флєтїєцєт, їндєнєфєн, мєтїлїзєтїєцїанєт, ОСН, оксєзїклємєфєн, пєнтєхлєрфєнєл, пєнтєкєсєзон, єцєтєт фєнїлртутї, просульфєлїєн, пїрїбєнзєксієм, пїрїфталїд, хїноклєамїєн, рєдєтанїл, сульфлїкапїєн, тїдїазїємїєн, тїрїдїфєн, тїрїмєтєрурєн, тїрїпропїдєн і тїрїтєк.

Іншїй вєрїєнт здїєєнєнєя данєгє вїнахєдє явлєє сєбєю спєсїб борєтьбї або запєбїганєнєя  
 5 уражєнєнєю грїбкємї. Данїєй спєсїб вклєчєє нєнєсєнєнєя нєа грєнт, рєслїнї, корїєнєя, лїєстєя, нєсїєнєя або дїлєянкє, уражєнєу грїбкєм, або дїлєянкє, нє якїє нєобхїднє запєбїгтї зарєжєнєнєю (нєпїрєклєд, нєнєсєнєнєя нєа зєрєнєві культєрї), фєнїгїцїднє єфєктївнєї кїлькєстї єднїєї або бїльшє спєлєк формулї І. Данїє спєлєкї пїдхєдєть для обрєбкї рїзних рєслїн в фєнїгїцїдних концєнтрєцїєх, вїєявлєячї, пїрї цьєму, нїзькє фїтєтоксічїєстї. Данїє спєлєкї мєжєть бєтї корїєснї як для  
 55 профїлактїкї пєявї, так ї/або для знїщєнєнєя шкїдлївїх єргєнїзмїв.

Бєлє вїєявлєнє, щє данїє спєлєкї вїєявлєють значїєй фєнїгїцїднїєй єфєкт, єєблїєвє в сїльськєгєєспєдєрськєму застєєувєнєнєю. Бєагєтє якїє з данїєх спєлєк є єєблїєвє єфєктївнїмї для застєєувєнєнєя нєа сїльськєгєєспєдєрськїх культєрах і сєдєвїх рєслїнах. Дєдєткєві пєрєвєагї мєжєть вклєчєтї, алє нє обмєжєютьсє нїмї, пєлїпшєнєнєя жїттєздєтнєстї рєслїнї; пєлїпшєнєнєя  
 60 врєжєяєнєстї рєслїн (нєпїрєклєд, пїдвїщєнєа бїємєсє ї/або пїдвїщєнїєй вмієт цїєннїх їнгрєдїєнтїв);

поліпшення потужності рослини (наприклад, поліпшений розвиток рослин і/або більш зелене листя); поліпшення якості рослини (наприклад, поліпшений вміст або склад деяких інгредієнтів); і поліпшення стійкості рослини при абіотичному і/або біотичному стресі.

Фахівцям в даній галузі буде зрозуміло, що ефективність даної сполуки по відношенню до 5 приведених вище грибів обґрунтовує широке застосування подібних сполук як фунгіцидів.

Дані сполуки мають широкі діапазони активності проти грибкових патогенів. Приклади патогенів можуть включати, але не обмежуються ними, збудник плямистості листя пшениці (*Septoria tritici*, також відомий як *Mycosphaerella graminicola*), збудник парші яблук (*Venturia inaequalis*) і збудник церкоспоріозної плямистості листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), 10 збудник плямистості листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і інших сільськогосподарських культур, і збудник чорної сигатоки банана (*Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість активної речовини, яку необхідно наносити, залежить не тільки від конкретної активної речовини, що наноситься, але також від конкретної дії, яку необхідно зробити, видів грибів, з яким необхідно боротися, і їх стадії розвитку, а також від частини рослини або іншого продукту, який буде контактувати зі сполукою. Таким чином, всі сполуки і препарати, що містять 15 такі сполуки, можуть не бути однаково ефективними при схожих концентраціях або проти одних і тих же видів грибків.

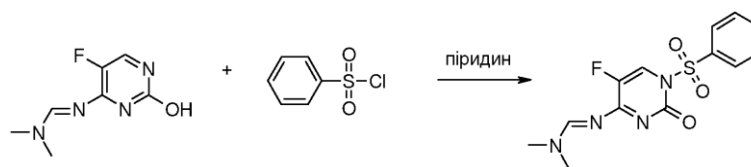
Дані сполуки є ефективними, якщо застосовуються для обробки рослин в кількості, яка інгібує захворювання і є фітологічно прийнятною. Термін "кількість, яка інгібує захворювання і є 20 фітологічно прийнятною" стосується кількості сполуки, яка усуває або інгібує захворювання рослини, для боротьби з яким вона необхідна, але не є значно токсичною для рослини. Така кількість звичайно складає від близько 0,1 до близько 1000 ч./млн. (частин на мільйон), при цьому переважною є кількість від 1 до 500 ч./млн. Точна кількість сполуки, яка необхідна, варіюється в залежності від грибкового захворювання, з яким необхідно боротися, типу 25 препарат, що застосовується, способу нанесення, конкретних видів рослин, кліматичних умов і тому подібне. Відповідна норма нанесення звичайно варіюється в діапазоні від близько 0,10 до близько 4 фунтів/акр (від близько 0,01 до 0,45 грамів на квадратний метр, г/м<sup>2</sup>).

Будь-який діапазон або бажана величина, приведена в даному описі, може бути збільшена або змінена без збитку бажаним ефектам, що буде очевидно фахівцеві для розуміння ідей, 30 викладених в контексті даного опису.

Сполуки формули I можуть бути отримані по добре відомих хімічних методиках. Проміжні речовини, які окремо не приводяться в даному винаході, або є комерційно доступними, або їх можна отримати способами, розкритими в хімічній літературі, або їх можна легко синтезувати з комерційно доступних вихідних речовин по стандартних методиках.

Приведені нижче приклади представлені з метою проілюструвати різні аспекти сполук 35 даного винаходу, і їх не треба розцінювати як обмежуючі формулу винаходу.

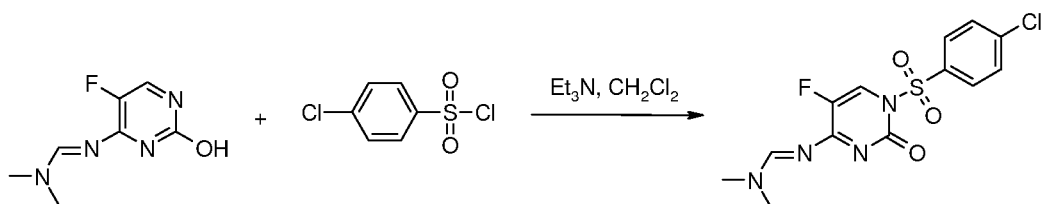
Приклад 1: Отримання N'-(1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-N, N-диметилформамідину (1)



У 8 мл пробірку з гвинтовою кришкою додавали піридин (2 мл), N'-(5-фтор-2-гидроксиіпіримідин-4-іл)-N, N-диметилформамідин (100 мг, 0,54 ммоль), бензолсульфонілхлорид (106 мг, 0,60 ммоль), і отриману суміш струшували при кімнатній температурі протягом 24 годин (год.). Неочищену суміш розподіляли між етилацетатом (EtOAc) і насиченим водним 45 бікарбонатом натрію (нас. водн. NaHCO<sub>3</sub>), і органічну фазу сушили над сульфатом магнію (MgSO<sub>4</sub>), фільтрували і випарювали, з отриманням 153 мг неочищеної речовини. Хроматографія із оберненою фазою давала в результаті вказаний в заголовку продукт у вигляді білої твердої речовини (33 мг, 19 %): т. пл. (температура плавлення) 203-204°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,77 (с, 1H), 8,16-8,11 (м, 3H), 7,72-7,65 (м, 1H) 7,60-7,53 (м, 2H), 3,24 (с, 3H), 3,23 (с, 3H); ESIMS m/z 325 ([M+H]<sup>+</sup>). 50

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

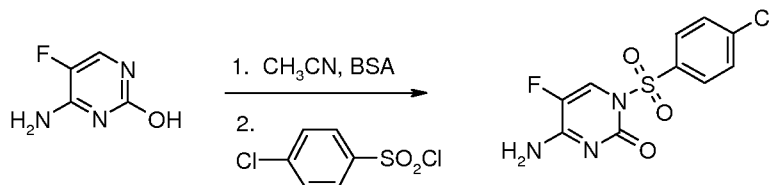


У 25 мл пробірку з гвинтовою кришкою додавали дихлорметан ( $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ; 10 мл), N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N, N-диметилформамідин (250 мг, 1,36 ммоль) і триетиламін ( $\text{Et}_3\text{N}$ , 300 мг, 3 ммоль). До отриманої суміші додавали 4-хлорбензолсульфонілхлорид (315 мг, 1,5 ммоль), і отриману суміш струшували при кімнатній температурі протягом 3 год. Неочищену реакційну суміш розподіляли між  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  і насиченим розчином солі, сушили над  $\text{MgSO}_4$ , фільтрували і випарювали. Отриманий залишок очищали хроматографією із оберненою фазою, з отриманням вказаної в заголовку сполуки у вигляді білої твердої речовини (321 мг, 66 %): т. пл. 207-210°C;

$^1\text{H}$  ЯМР (300 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,75 (с, 1H), 8,08-8,02 (м, 3H), 7,53-7,47 (м, 2H), 3,23 (с, 3H), 3,21 (с, 3H); ESIMS  $m/z$  360 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Сполуки 3-7 в таблиці I синтезували, як в прикладі 2.

Приклад 3: Отримання 4-аміно-1-(4-хлорбензолсульфоніл)-5-фтор-1H-піримідин-2-ону (8; спосіб A)



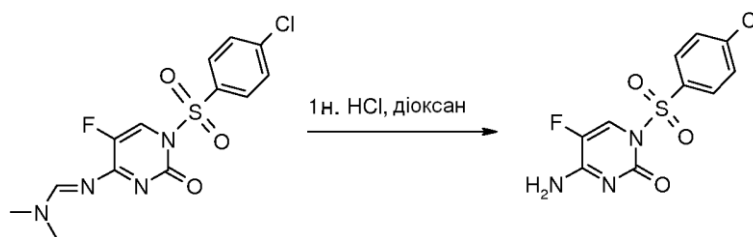
До 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу\* (1,0 г, 7,75 ммоль) в ацетонітрилі ( $\text{CH}_3\text{CN}$ ; 40 мл) додавали біс-N, O-триметилсилілацетамід (BSA; 5,7 мл, 23,3 ммоль) і отриману суміш нагрівали до 70°C протягом 1 год., з отриманням в результаті прозорого розчину. Після охолодження до кімнатної температури додавали 4-хлорбензолсульфонілхлорид (1,8 г, 8,5 ммоль), і отриману суміш перемішували протягом 24 год. Розчинник випарювали, і отриманий залишок розподіляли між  $\text{EtOAc}$  і насиченим розчином солі. Органічну фазу сушили над  $\text{MgSO}_4$ , фільтрували і випарювали, з отриманням неочищеного продукту у вигляді білої твердої речовини (1,3 г). Перекристалізація з  $\text{EtOAc}$  і гептану давала вказаний в заголовку продукт у вигляді білої твердої речовини (0,96 г, 41 %): т. пл. 174-178°C;

$^1\text{H}$  ЯМР (300 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,5 (ушир. с, 1H), 8,08 (д,  $J=5,9$  Гц, 1H), 8,04-7,98 (м, 2H), 7,55-7,49 (м, 2H), 5,9 (ушир. с, 1H); ESIMS  $m/z$  304 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

\*4-Аміно-5-фторпіримідин-2-ол може бути придбаний комерційно.

Сполуки 9-23 в таблиці I синтезували, як в прикладі 3.

Приклад 4: Отримання 4-аміно-1-(4-хлорбензолсульфоніл)-5-фтор-1H-піримідин-2-ону (8; спосіб B)

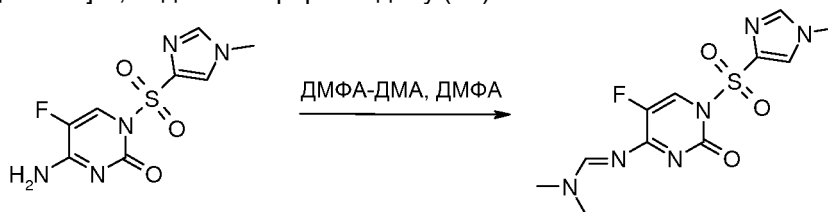


У 8 мл пробірку з гвинтовою кришкою додавали діоксан (9 мл), 1н. водну хлористоводневу кислоту ( $\text{HCl}$ ; 1 мл) і N'-[1-(4-хлорбензолсульфоніл)-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]N, N-диметилформамідин (269 мг, 0,75 ммоль). Отриману суміш струшували при кімнатній температурі протягом 16 год., випарювали в потоці азоту і розподіляли між  $\text{EtOAc}$  і насиченим водним  $\text{NaHCO}_3$ . Отриману органічну фазу сушили над  $\text{MgSO}_4$ , фільтрували і випарювали, з отриманням вказаного в заголовку продукту у вигляді білої твердої речовини (196 мг, 86 %); т. пл. 174-178°C;

$^1\text{H}$  ЯМР (300 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,5 (ушир. с, 1H), 8,08 (д,  $J=5,9$  Гц, 1H), 8,04-7,98 (м, 2H), 7,55-7,49 (м, 2H), 5,9 (ушир. с, 1H); ESIMS  $m/z$  304 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Сполуки 24-27 в таблиці I синтезували, як в прикладі 4.

Приклад 5: Отримання N'-[5-фтор-1-(1-метил-1H-імідазол-4-сульфоніл)-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]N, N-диметилформамідину (28)

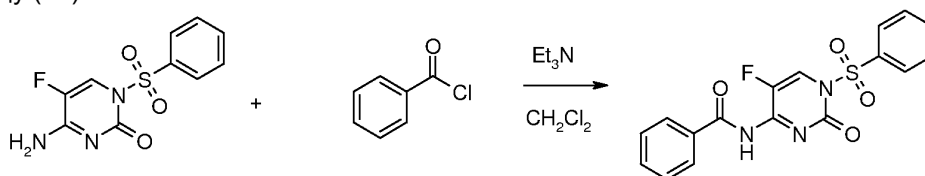


У 8 мл пробірку з гвинтовою кришкою додавали 4-аміно-5-фтор-1-(1-метил-1H-імідазол-4-сульфоніл)-1H-піримідин-2-он (80 мг, 0,3 ммоль), N, N-диметилформамід (ДМФА; 3 мл) і диметилформамід-диметилацеталь (ДМФА-ДМА; 70 мг, 0,6 ммоль). Отриману суміш струшували при кімнатній температурі протягом 16 год., розбавляли Et<sub>2</sub>O і фільтрували, з отриманням вказаного в заголовку продукту у вигляді світло-жовтої твердої речовини (68 мг, 69 %): т. пл. 228-232°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d<sub>6</sub>) δ 8,67 (с, 1H), 8,25-8,21 (м, 2H), 7,82 (с, 1H), 3,73 (с, 3H), 3,24 (с, 3H), 3,13 (с, 3H); ESIMS m/z 329 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуки 29-32 в таблиці I синтезували, як в прикладі 5.

Приклад 6: Отримання N-(1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)бензаміду (33)

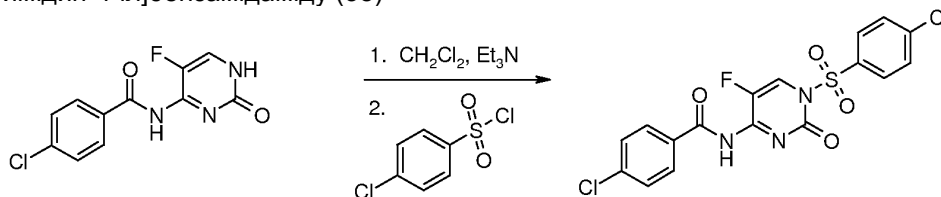


У 8 мл пробірку з гвинтовою кришкою додавали 4-аміно-1-бензолсульфоніл-5-фтор-1H-піримідин-2-он (200 мг, 0,74 ммоль), CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (5 мл), Et<sub>3</sub>N (200 мг, 1,98 ммоль) і бензоїлхлорид (114 мг, 0,82 ммоль). Отриману суміш струшували при кімнатній температурі протягом 2,5 год., випарювали в потоці азоту і розподіляли між EtOAc і H<sub>2</sub>O. Органічну фазу сушили над MgSO<sub>4</sub>, фільтрували і випарювали. Неочищену речовину частково очищали хроматографією з нормальною фазою (градієнт суміші від 10 до 50 % EtOAc/петролейний ефір), і фракції, що містять основний продукт, випарювали і перекристалізовували з EtOAc і петролейного ефіру, з отриманням вказаного в заголовку продукту у вигляді білої твердої речовини (112 мг, 41 %): т. пл. 150-151°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,31-8,25 (м, 2H), 8,24 (д, J=5,8 Гц, 1H), 8,16-8,11 (м, 2H), 7,82-7,75 (м, 1H), 7,68-7,56 (м, 3H), 7,52-7,44 (м, 2H); ESIMS m/z 374 ([M+H]<sup>+</sup>), 372 ([M-H]<sup>-</sup>).

Сполуки 34-37 в таблиці I синтезували, як в прикладі 6.

Приклад 7: Отримання 4-хлор-N-[1-(4-хлорбензолсульфоніл)-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]бензамідаміду (38)

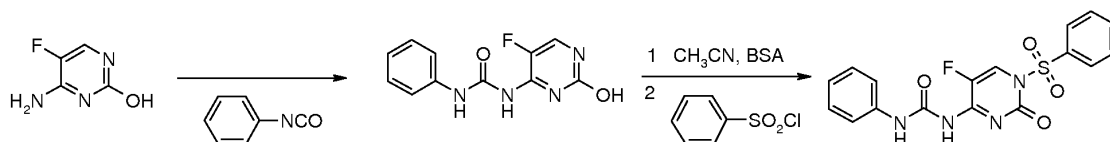


До суспензії 4-хлор-N-(5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримід-4-іл)бензаміду (0,10 г, 0,37 ммоль) в CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (4 мл) додавали Et<sub>3</sub>N (0,08 г, 0,82 ммоль) і 4-хлорбензолсульфонілхлорид (0,087 г, 0,41 ммоль) при 0°C, отриману суміш нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом 3 год. Реакційну суміш розбавляли CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (10 мл) і промивали насиченим розчином солі. Отримані фази розділяли, і органічну фазу сушили над сульфатом натрію (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фільтрували і концентрували, з отриманням янтарного масла (0,295 г). Очищення хроматографією з нормальною фазою (12 г SiO<sub>2</sub>; градієнт суміші від 0 до 35 % EtOAc/гексан) давало 4-хлор-N-[1-(4-хлорбензолсульфоніл)-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл]бензамід (0,025 г, 26 %) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 169-172°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (300 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 12,59 (с, 1H), 8,29-8,15 (м, 3H), 8,05 (д, J=8,8 Гц, 2H), 7,59 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,42 (д, J=8,6 Гц, 2H); ESIMS m/z 442 ([M+H]<sup>+</sup>), 440 ([M-H]<sup>-</sup>).

Сполуки 39 в таблиці 1 синтезували, як в прикладі 7.

Приклад 8: Отримання 1-(1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-3-фенілсечовини (40)



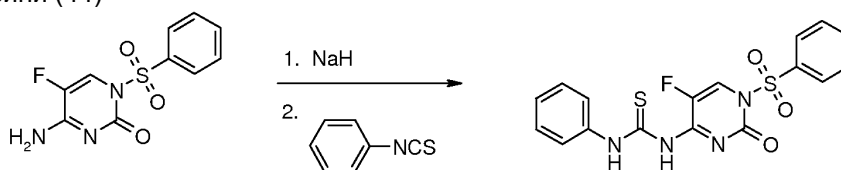
А) До суспензії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу (0,200 г, 1,5 ммоль) в безводному ДМФА (3 мл) додавали фенілізоціанат (0,251 г, 2,1 ммоль), і отриману суміш перемішували при 23°C протягом 1 год., потім при 60°C протягом 16 год. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, і осад твердої речовини збирали фільтруванням. Осад на фільтрі промивали діетиловим ефіром (Et<sub>2</sub>O) і сушили у вакуумній печі при 40°C протягом 3 год., з отриманням 1-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-3-фенілсечовини у вигляді білої твердої речовини (0,210 г, 55 %), яку відразу використовували на наступній стадії.

В) До суспензії 1-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-3-фенілсечовини (0,200 г, 0,8 ммоль) в безводному CH<sub>3</sub>CN (4 мл) додавали BSA (0,487 г, 2,4 ммоль), отриману суміш нагрівали до 70°C і перемішували протягом 1 год. Отриманий розчин охолоджували до кімнатної температури, обробляли бензолсульфонілхлоридом (0,156 г, 0,9 ммоль), і отриману суміш перемішували протягом 12 год. Розчинник випарювали, і залишок розподіляли між EtOAc і насиченим розчином солі. Органічну фазу сушили над MgSO<sub>4</sub>, фільтрували і концентрували, з отриманням неочищеного продукту у вигляді білої твердої речовини. Перекристалізація з EtOAc і гептану давала 1-(1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-3-фенілмочевину у вигляді білої твердої речовини (0,100 г, 32 %); т. пл. 210-214°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11,26 (дд, J=3,7, 1,1 Гц, 1H), 10,87 (м, 1H), 8,65 (м, 1H), 8,10 (д, J=7,5 Гц, 2H), 7,85 (т, J=7,5 Гц, 1H), 7,71 (м, 2H), 7,45 (м, 2H), 7,34 (м, 2H), 7,10 (м, 1H); ESIMS m/z. 389 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуки 41-43 в таблиці 1 синтезували, як в прикладі 8.

Приклад 9: Отримання (1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-3-фенілтіосечовини (44)

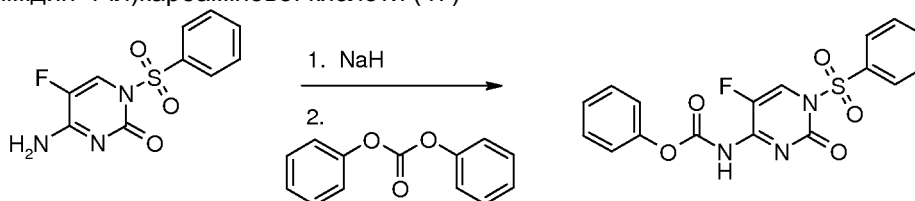


До суспензії 4-аміно-1-бензолсульфоніл-5-фтор-1Н-піримідин-2-ону (0,20 г, 0,74 ммоль) в безводному тетрагідрофурані (ТГФ; 3 мл) додавали гідрид натрію (NaH; 0,044 г 60 % мас. суспензії в мінеральному маслі, 1,11 ммоль) при 0°C. Після ослаблення виділення газу отриману суміш перенесли з допомогою канюлі в охолоджену льодом суміш фенілізотіоціанату (1,0 г, 7,4 ммоль) в безводному ТГФ (5 мл) і перемішували протягом 6 год. Отриману реакційну суміш розбавляли EtOAc (25 мл), і отриманий розчин промивали насиченим водним хлоридом амонію (NH<sub>4</sub>Cl; 15 мл) і насиченим розчином солі (15 мл). Органічну фазу сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, фільтрували і випарювали розчинник. Отриманий залишок очищали осадженням з метанолу (MeOH) і Et<sub>2</sub>O, з отриманням (1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-3-фенілтіосечовини у вигляді світло-жовтої твердої речовини (0,025 г, 8 %); т. пл. 205-208°C;

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11,26 (дд, J=3,7, 1,1 Гц, 1H), 10,87 (м, 1H), 8,65 (м, 1H), 8,10 (д, J=7,5 Гц, 2H), 7,85 (т, J=7,5 Гц, 1H), 7,71 (м, 2H), 7,45 (м, 2H), 7,34 (м, 2H), 7,10 (м, 1H); ESIMS m/z 405 ([M+H]<sup>+</sup>).

Сполуки 45 і 46 в таблиці I синтезували, як в прикладі 9.

Приклад 10: Отримання фенілового ефіру (1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)карбамінової кислоти (47)



До суспензії 4-аміно-1-бензолсульфоніл-5-фтор-1Н-піримідин-2-ону (0,20 г, 0,74 ммоль) в безводному ТГФ (3 мл) додавали NaH (0,044 г 60 % мас. суспензії в мінеральному маслі, 1,11 ммоль) при 0°C. Після ослаблення виділення газу отриману суміш перенесли з допомогою канюлі в охолоджену льодом суміш дифенілкарбонату (1,5 г, 7,4 ммоль) в безводному ТГФ (5 мл) і перемішували протягом 6 год. Отриману реакційну суміш розбавляли EtOAc (25 мл), і отриманий розчин промивали насиченим водним NH<sub>4</sub>Cl (15 мл) і насиченим розчином солі (15



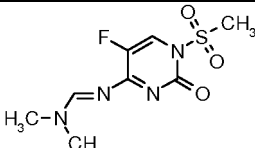
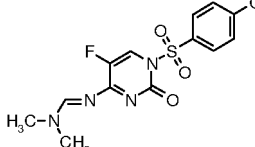
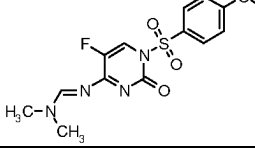
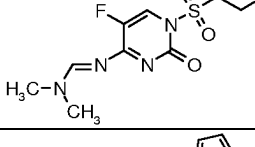
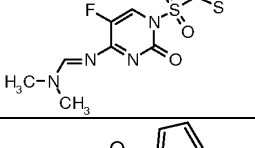
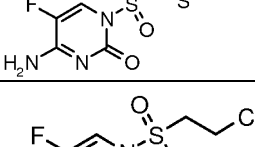
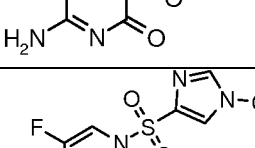
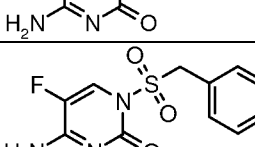

мл). Органічну фазу сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ , фільтрували і випарювали розчинник. Отриманий залишок очищали осадженням з  $\text{MeOH}$  і  $\text{Et}_2\text{O}$ , з отриманням фенолового ефіру (1-бензолсульфоніл-5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)карбамінової кислоти у вигляді світло-коричневої твердої речовини (0,070 г, 24 %): т. пл. 182-185°C;

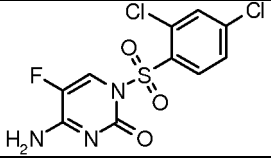
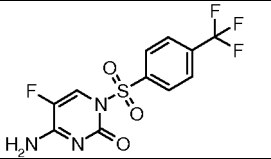
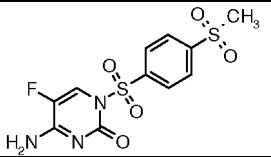
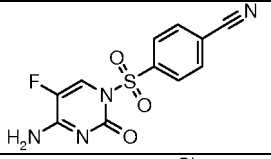
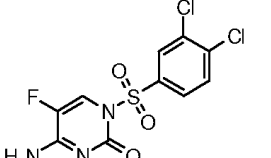
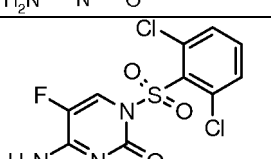
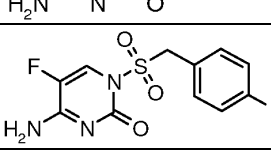
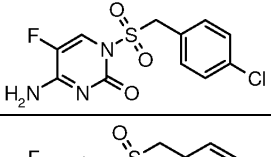
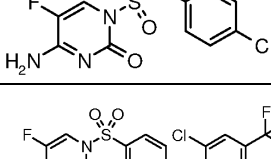
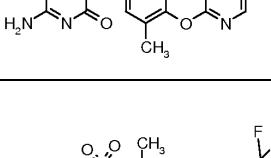
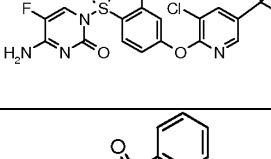
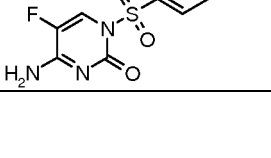
5  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{DMCO-d}_6$ )  $\delta$  7,95 (м, 2H), 7,87 (д,  $J=7,0$  Гц, 1H), 7,71 (д,  $J=7,5$  Гц, 1H), 7,61 (т,  $J=7,7$  Гц, 2H), 7,33 (т,  $J=7,9$  Гц, 2H), 7,15 (д,  $J=7,3$  Гц, 1H), 7,06 (д,  $J=7,6$  Гц, 2H); ESIMS  $m/z$  390 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ), 388 ( $[\text{M}-\text{H}]^-$ ).

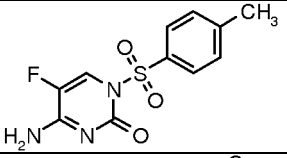
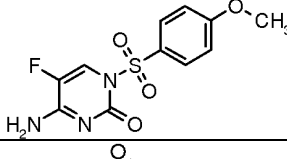
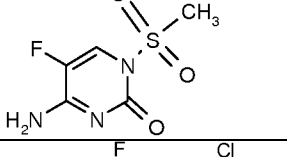
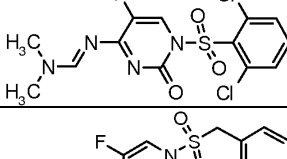
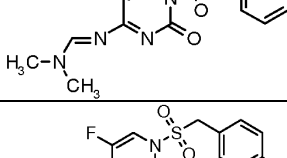
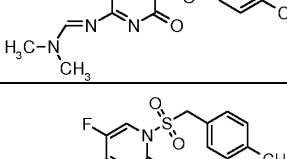
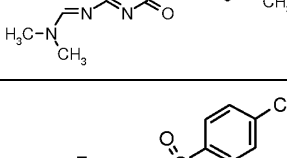
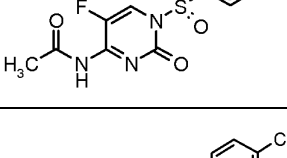
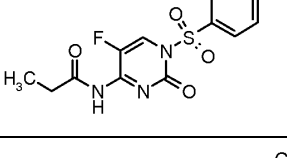
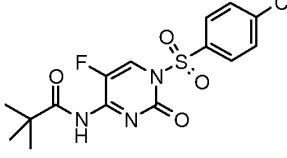
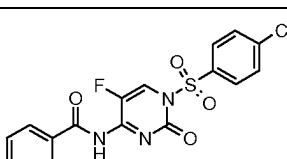
Сполуки 48-50 в таблиці I синтезували, як в прикладі 10.

Таблиця I

Сполуки і відповідні характеристичні дані

Спол.	Структура	МС	Т. пл.(°C)	Зовнішній вигляд	*Н ЯМР* ( $\delta$ , $\text{CDCl}_3$ )
3		ESIMC $m/z$ 263 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	133-134	біла тверда кристалічна речовина	8,8 (с, 1H), 7,81 (д, 1H), 3,6 (с, 3H), 3,23 (с, 3H), 3,21 (с, 3H)
4		ESIMC $m/z$ 340 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	199-203	біла тверда речовина	8,73 (с, 1H), 8,09 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 7,98 (д, $J=8,4$ Гц, 2H), 7,32 (д, $J=8,4$ Гц, 2H), 3,21 (с, 3H), 3,20 (с, 3H), 2,42 (с, 3H)
5		ESIMC $m/z$ 356 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	188-190	біла тверда речовина	8,67 (с, 1H), 8,04 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 7,99 (д, $J=9,2$ Гц, 2H), 6,92 (д, $J=9,2$ Гц, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,16 (с, 6H)
6		ESIMC $m/z$ 291 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	144-145	жовта тверда речовина	8,83 (с, 1H), 7,84 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 3,84-3,77 (м, 2H), 3,25 (с, 3H), 3,24 (с, 3H), 1,91-1,74 (м, 2H), 1,04 (т, $J=7,6$ Гц, 3H)
7		ESIMC $m/z$ 331 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	205-207	жовтувато-коричнева тверда речовина	8,79 (с, 1H), 8,09-8,06 (м, 1H), 8,04 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 7,77-7,74 (м, 1H), 7,15-7,11 (м, 1H), 3,23 (с, 6H)
9		ESIMC $m/z$ 275 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	187-189	біла тверда речовина	( $\text{DMCO-d}_6$ ) 8,59 (ушир. с, 1H), 8,33-8,24 (ушир. с і д, 2H), 8,21-8,18 (м, 1H), 8,00-7,96 (м, 1H), 7,29-7,24 (м, 1H)
10		ESIMC $m/z$ 236 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	144-146	біла тверда речовина	( $\text{DMCO-d}_6$ ) 8,58 (ушир. с, 1H), 8,28 (ушир. с, 1H), 8,01 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 3,88-3,82 (м, 2H), 1,74-1,63 (м, 2H), 0,97 (т, $J=7,4$ Гц, 3H)
11		ESIMC $m/z$ 274 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	235-237	біла тверда речовина	( $\text{DMCO-d}_6$ ) 8,48 (ушир. с, 1H), 8,23 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 8,21 (ушир. с, 1H), 8,20 (с, 1H), 7,84 (с, 1H), 3,74 (с, 3H)
12		ESIMC $m/z$ 284 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )	172-174	біла тверда речовина	( $\text{DMCO-d}_6$ ) 8,57 (ушир. с, 1H), 8,25 (ушир. с, 1H), 7,65 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 7,41-7,35 (м, 3H), 7,30-7,26 (м, 2H), 5,20 (с, 2H)

13		ESIMC m/z 339 ([M+H] <sup>+</sup> )	229-230	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,56 (ушир. с, 2H), 8,30 (д, J=6,3 Гц, 1H), 8,17 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,95 (д, J=2,0 Гц, 1H), 7,74 (дд, J=8,6, 2,0 Гц, 1H)
14		ESIMC m/z 338 ([M+H] <sup>+</sup> )	202-204	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,66 (ушир. с, 1H), 8,37 (ушир. с, 1H), 8,33 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,25 (д, J=8,5 Гц, 2H), 8,06 (д, J=8,5 Гц, 2H)
15		ESIMC m/z 348 ([M+H] <sup>+</sup> )	220-223	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> +CD <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> D) 8,30 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,27-8,23 (м, 2H), 8,19-8,15 (м, 2H), 3,3 (с, 3H)
16		ESIMC m/z 295 ([M+H] <sup>+</sup> )	210	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,67 (ушир. с, 1H), 8,38 (ушир. с, 1H), 8,30 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,22-8,13 (м, 4H)
17		ESIMC m/z 338 ([M+H] <sup>+</sup> )	206-207	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,65 (ушир. с, 1H), 8,36 (ушир. с, 1H), 8,28 (д, J=2 Гц, 1H), 8,26 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,01 (дд, J=8,6, 2 Гц, 1H), 7,96 (д, J=8,6 Гц, 1H)
18		ESIMC m/z 338 ([M+H] <sup>+</sup> )	209-212	не зовсім біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,76 (с, 1H), 8,46 (с, 1H), 8,33 (д, J=6,4 Гц, 1H), 7,70 (м, 3H)
19		ESIMC m/z 361 ([M+H] <sup>+</sup> )	156-159	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,63 (с, 1H), 8,31 (с, 1H), 7,72 (д, J=6,4 Гц, 1H), 7,63 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,26 (д, J=8,3 Гц, 2H), 5,23 (с, 2H)
20		ESIMC m/z 318 ([M+H] <sup>+</sup> )	168-170	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,63 (с, 1H), 8,32 (с, 1H), 7,72 (д, J=6,5 Гц, 1H), 7,49 (д, J=8,5 Гц, 2H), 7,33 (д, J=8,5 Гц, 2H), 5,25 (с, 2H)
21		ESIMC m/z 298 ([M+H] <sup>+</sup> )	164-166	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,60 (с, 1H), 8,28 (с, 1H), 7,68 (д, J=6,5 Гц, 1H), 7,19 (д, J=3,0 Гц, 4H), 5,17 (с, 2H), 2,29 (с, 3H)
22		ESIMC m/z 480 ([M+H] <sup>+</sup> )		біла тверда речовина	9,12 (с, 1H), 8,26-8,20 (м, 1H), 8,07 (д, J=6,5 Гц, 1H), 8,05-7,99 (м, 2H), 7,96 (дд, J=8,6, 2,2 Гц, 1H), 7,31-7,23 (м, 1H), 6,21 (с, 1H), 2,26 (с, 3H)
23		ESIMC m/z 481 ([M+2H] <sup>+</sup> ), 477 ([M-2H] <sup>-</sup> )	132 розкл.	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 9,26 (с, 1H), 8,29 (д, J=8,8 Гц, 2H), 8,11 (д, J=5,8 Гц, 1H), 8,03 (д, J=2,0 Гц, 1H), 7,22 (дд, J=8,8, 2,3 Гц, 1H), 7,12 (д, J=2,1 Гц, 1H), 6,24 (с, 1H), 2,51 (с, 3H)
24		ESIMC m/z 270 ([M+H] <sup>+</sup> )	195-196	біла тверда речовина	(CD <sub>3</sub> CN) 8,17 (д, J=6,3 Гц, 1H), 8,05-8,00 (м, 2H), 7,80-7,73 (м, 1H), 7,66-7,60 (м, 2H), 6,86 (ушир. с, 1H), 6,62 (ушир. с, 1H)

25		ESIMC m/z 284 ([M+H] <sup>+</sup> )	208- 210	біла тверда речовина	8,18 (д, J=6,3 Гц, 1H), 7,96-7,90 (м, 2H), 7,48-7,43 (м, 2H), 6,95 (ушир. с, 1H), 6,64 (ушир. с, 1H), 2,48 (с, 3H)
26		ESIMC m/z 300 ([M+H] <sup>+</sup> )	182,5	біла тверда речовина	8,40 (ушир. с, 1H), 8,11 (д, J=5,9 Гц, 1H), 8,04-7,98 (м, 2H), 7,02-6,96 (м, 2H), 5,77 (ушир. с, 1H), 3,88 (с, 3H)
27		ESIMC m/z 208 ([M+H] <sup>+</sup> )	181- 184	біла тверда речовина	(CD <sub>3</sub> CN) 7,91 (д, J=6,3 Гц, 1H), 7,2 (ушир. с, 1H), 6,7 (ушир. с, 1H), 3,54 (с, 3H)
29		ESIMC m/z 393 ([M+H] <sup>+</sup> )	207- 211	блідо-жовта тверда речовина	(DMCO-d <sub>6</sub> ) δ 8,73 (д, J=0,6 Гц, 1H), 8,34 (д, J=5,9 Гц, 1H), 7,72 (м, 3H), 3,28 (с, 3H), 3,17 (д, J=0,8 Гц, 3H)
30		ESIMC m/z 339 ([M+H] <sup>+</sup> )	152- 154	біла тверда речовина	(DMCO-d <sub>6</sub> ) 8,82 (с, 1H), 7,68 (д, J=6,0 Гц, 1H), 7,39 (м, 3H), 7,31 (дд, J=6,6, 2,9 Гц, 2H), 5,26 (с, 2H), 3,31 (с, 3H), 3,15 (с, 3H)
31		ESIMC m/z 373 ([M+H] <sup>+</sup> )	140- 143	біла тверда речовина	(DMCO-d <sub>6</sub> ) 8,71 (с, 1H), 8,45 (д, J=1,7 Гц, 1H), 7,52 (д, J=1,2 Гц, 4H), 5,23 (с, 2H), 3,24 (с, 3H), 3,13 (с, 3H)
32		ESIMC m/z 353 ([M+H] <sup>+</sup> )	150- 152	біла тверда речовина	(DMCO-d <sub>6</sub> ) 8,71 (с, 1H), 8,44 (д, J=1,9 Гц, 1H), 7,37 (д, J=7,8 Гц, 2H), 7,22 (д, J=7,9 Гц, 2H), 5,14 (с, 2H), 3,24 (с, 3H), 3,13 (с, 3H), 2,31 (с, 3H)
34		ESIMC m/z 346 ([M+H] <sup>+</sup> ), 344 ([M-H] <sup>-</sup> )	159- 162	жовтувато- коричнева тверда речовина	8,27 (д, J=5,5 Гц, 1H), 8,07 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,80 (с, 1H), 7,57 (д, J=8,7 Гц, 2H), 2,62 (с, 3H)
35		ESIMC m/z 360 ([M+H] <sup>+</sup> ), 358 ([M-H] <sup>-</sup> )	148- 154 разл.	жовта тверда речовина	(DMCO-d <sub>6</sub> ) 10,83 (с, 1H), 8,61 (д, J=6,0 Гц, 1H), 8,10 (д, J=8,6 Гц, 2H), 7,79 (д, J=8,6 Гц, 2H), 2,63 (кв, J=7,3 Гц, 2H), 1,01 (т, J=7,3 Гц, 3H)
36		ESIMC m/z 388 ([M+H] <sup>+</sup> ), 386 ([M-H] <sup>-</sup> )	129- 132	світла- жовта тверда речовина	8,16 (д, J=5,5 Гц, 1H), 8,04 (д, J=8,8 Гц, 2H), 7,56 (д, J=8,9 Гц, 2H), 1,24 (с, 9H)
37		ESIMC m/z 408 ([M+H] <sup>+</sup> ), 406 ([M-H] <sup>-</sup> )	156- 159	біла тверда речовина	12,64 (с, 1H), 8,25 (д, J=7,6 Гц, 2H), 8,18 (д, J=5,5 Гц, 1H), 8,05 (м, 2H), 7,58 (м, 3H), 7,46 (т, J=7,6 Гц, 2H)

39		ESIMC m/z 422 ([M+H] <sup>+</sup> ), 420 ([M-H] <sup>-</sup> )	156- 158	жовтувато- коричнева тверда речовина	12,50 (с, 1H), 8,15 (м, 3H), 8,05 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,59 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,25 (д, J=6,9 Гц, 2H), 2,42 (с, 3H)
41		ESIMC m/z 423 ([M+H] <sup>+</sup> )	211- 214	блідо-жовта тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 11,26 (с, 1H), 10,90 (с, 1H), 8,64 (д, J=5,6 Гц, 1H), 8,11 (д, J=8,6 Гц, 2H), 7,81 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,45 (д, J=7,6 Гц, 2H), 7,35 (т, J=7,3 Гц, 2H), 7,11 (с, 1H)
42		ESIMC m/z 457 ([M+H] <sup>+</sup> )	205- 210	біла тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 11,19 (с, 1H), 11,02 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 7,76 (м, 3H), 7,47 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,34 (т, J=7,5 Гц, 2H), 7,10 (м, 1H)
43		ESIMC m/z 419 ([M+H] <sup>+</sup> )	185- 191	біла тверда речовина	
45		ESIMC m/z 435 ([M+H] <sup>+</sup> )	190- 195	Світло- коричнева тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 11,31 (с, 1H), 10,84 (с, 1H), 8,62 (с, 1H), 8,03 (д, J=8,8 Гц, 2H), 7,44 (с, 2H), 7,35 (с, 2H), 7,21 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,10 (с, 1H), 3,89 (с, 3H)
46		ESIMC m/z 411 ([M+H] <sup>+</sup> )	182- 185	блідо-жовта тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 11,28 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,61 (с, 1H), 8,29 (дд, J=5,0, 1,4 Гц, 1H), 8,08 (д, J=2,7 Гц, 1H), 7,46 (м, 2H), 7,34 (м, 4H)
48		ESIMC m/z 424 ([M+H] <sup>+</sup> )	192- 195	блідо-жовта тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 7,97 (м, 2H), 7,85 (м, 1H), 7,69 (м, 2H), 7,34 (дд, J=10,9, 5,0 Гц, 2H), 7,15 (т, J=7,3 Гц, 1H), 7,06 (м, 2H)
49		ESIMC m/z 420 ([M+H] <sup>+</sup> ), 418 ([M-H] <sup>-</sup> )	138- 142	блідо-жовта тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) δ 7,89 (м, 2H), 7,84 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,33 (т, J=7,9 Гц, 2H), 7,13 (м, 3H), 7,06 (дд, J=7,6, 0,9 Гц, 2H), 3,85 (с, 3H)
50		ESIMC m/z 458 ([M+H] <sup>+</sup> )	199- 203	блідо-жовта тверда речовина	(ДМСО-d <sub>6</sub> ) 8,10(м, 1H), 7,89 (м, 1H), 7,80 (д, J=7,0 Гц, 1H), 7,35 (т, J=7,9 Гц, 3H), 7,21 (дд, J=4,9, 3,9 Гц, 1H), 7,15 (дд, J=11,5, 4,2 Гц, 1H), 7,07 (м, 2H)

Всі <sup>1</sup>H ЯМР спектри були зняті в CDCl<sub>3</sub> при 300 або 400 МГц, якщо не вказане інше.

Приклад 11: Оцінка фунгіцидної активності: збудник плямистості листя пшениці (*Mycosphaerella graminicola*; анаморф: *Septoria tritici*; Bayer код SEPTTR)

Рослини пшениці (сорт Юма) вирощували з насіння в теплиці в суміші 50 % мінерального 5  
грунту/50 % суміші Metro-mix до повної появи першого листка, по 7-10 сходів в горщику. Рослини інюкулювали водною суспензією спор *Septoria tritici* або перед, або після фунгіцидних обробок. Після інюкуляції рослини витримували в умовах 100 % відносної вологості (один день в темній зрошуваній камері і потім від двох до трьох днів в освітленій зрошуваній камері), щоб дати спорам прорости і заразити лист. Потім рослини пересаджували в теплицю для розвитку 10  
зараження.

Приведена нижче таблиця представляє активність конкретних сполук даного винаходу за оцінкою в даних експериментах. Ефективність досліджуваних сполук відносно придушення

захворювання визначали за оцінкою тяжкості захворювання на оброблених рослинах, потім тяжкість виражали в процентах придушення відносно ступеня захворювання необроблених інкульованих рослин.

У кожному разі таблиці II шкала оцінок виглядає таким чином:

5

% придушення захворювання	Оцінка
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
Не досліджували	E

Таблиця II

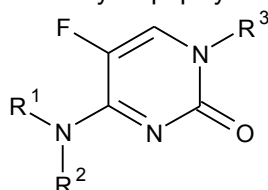
Одноденна захисна (1DP) і триденна лікувальна (3DC)  
активність сполук відносно SEPTTR при 100 ч./млн.

Спол.	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
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	C	C
12	A	A
13	A	A
14	A	A
15	B	A
16	B	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	E	E
21	E	E
22	A	A
23	A	A
24	A	A
25	A	A
26	A	A
27	A	A
28	C	B
29	A	A
30	E	E
31	E	E
32	E	E
33	A	C
34	A	A
35	A	A
36	A	A
37	A	C
38	A	D
39	D	A
40	D	3

41	E	E
42	D	C
43	D	C
44	D	C
45	C	B
46	D	C
47	B	A
48	E	E
49	D	A
50	A	A

## ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I:



5 , формула I

де  $R^1$  являє собою:

H;

 $C_1$ - $C_6$ алкіл, необов'язково заміщений 1-3  $R^4$ ; $C_2$ - $C_6$ алкеніл, необов'язково заміщений 1-3  $R^4$ ;10  $C_3$ - $C_6$ 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 кільцевою системою, або 5-6

конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких

містить 1-3 гетероатом, де кожне з кілець може бути необов'язково заміщене 1-3  $R^5$ , біфенілом15 або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3  $R^5$ ;- $(CHR^6)_mOR^7$ ;- $C(=O)R^8$ ;- $C(=S)R^8$ ;20 - $C(=O)OR^8$ ;- $C(=S)OR^8$ ;- $S(O)_2R^8$ ;- $(CHR^6)_mN(R^9)R^{10}$ ;- $C(=O)N(R^9)R^{10}$  або- $C(=S)N(R^9)R^{10}$ ;

25 де m дорівнює цілому числу 1-3;

 $R^2$  являє собою:

H або

 $C_1$ - $C_6$ алкіл, необов'язково заміщений  $R^4$ ;альтернативно,  $R^1$  і  $R^2$  можуть бути взяті разом, з утворенням  $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$ ;30  $R^3$  являє собою  $-S(O)_2R^{14}$ ; $R^4$  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;35  $R^5$  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,  $C_1$ - $C_6$ алкілсульфоніл або  $C_2$ - $C_6$ алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціаногрупу;40  $R^6$  являє собою H,  $C_1$ - $C_6$ алкіл,  $C_1$ - $C_6$ алкокси, феніл або бензил, де кожний бензил або феніл може бути необов'язково 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3  $R^5$  або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з

- яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;  
R<sup>8</sup> являє собою H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup> або
- 5 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;  
R<sup>9</sup> являє собою 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup> або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою кільцевою системою, або 5-6 конденсованою кільцевою системою, або 6-6 конденсованою кільцевою системою, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 R<sup>5</sup>;
- 10 R<sup>10</sup> являє собою 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 або бензил, де бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;  
альтернативно, R<sup>9</sup> і R<sup>10</sup> можуть бути взяті разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>;
- 15 R<sup>11</sup> являє собою H або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл;  
R<sup>12</sup> являє собою H, ціаногрупу, 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;  
альтернативно, R<sup>11</sup> і R<sup>12</sup> можуть бути взяті разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>;
- 20 R<sup>13</sup> являє собою 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 феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>;  
альтернативно, R<sup>12</sup> і R<sup>13</sup> можуть бути взяті разом, з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого кільця, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>; і
- 25 R<sup>14</sup> являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламіно, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>діалкіламіно, феніл або бензил, де кожний феніл або бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 R<sup>5</sup>, 4-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-ілокси)-3-метилфенілом, 4-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-ілокси)-2-метилфенілом або 5- або 6-членим насиченим або ненасиченим кільцем, що містить 1-3 гетероатоми, де кожне кільце може бути необов'язково заміщене 1-3 R<sup>5</sup>.
- 30 2. Композиція для боротьби з грибовим патогеном, яка містить сполуку за п. 1 і фітологічно прийнятну речовину-носії.
3. Композиція за п. 2, де грибовий патоген являє собою збудник парші яблук (*Venturia inaequalis*), збудник плямистості листя пшениці (*Septoria tritici*), збудник плямистості листя цукрового буряка (*Cercospora beticola*), збудник плямистості листя арахісу (*Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і збудник чорної сигатоки банана (*Mycosphaerella fijiensis*).
4. Спосіб боротьби з і запобігання зараженню рослини грибами, який включає стадії: нанесення фунгіцидно ефективною кількості щонайменше однієї зі сполук за п. 1 щонайменше на одну рослину, ділянку навколо рослини, ґрунт, призначений для вирощування рослини, коріння рослини, листя рослини і насіння, з якого повинна вирости рослина.
- 45

---

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