



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **107671**

(13) **C2**

(51) МПК

A01N 43/54 (2006.01)

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2012 02732	(72) Винахідник(и):	Бібель Тімоті (US), Брайан Крісті (US), Лорсбах Бет (US), Мартін Тімоті (US), Оуен В. (US), Побанс Марк (US), Торнберг Скотт (US), Вебстер Джеффри (US), Яо Ченлінь (US)
(22) Дата подання заявки:	05.08.2010	(73) Власник(и):	ДАУ АГРОСАЙЕНСІЗ ЕЛЕЛСІ, 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268- 1054, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.02.2015	(74) Представник:	Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/232,245	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	US 3309359 A, 14.03.1967 US 6066638 A, 23.05.2000 JP 60123486 A, 02.07.1985 WO 2009/094442 A2, 30.07.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	07.08.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	11.06.2012, Бюл.№ 11		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.02.2015, Бюл.№ 3		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	РСТ/US2010/044588, 05.08.2010		

(54) ПОХІДНІ N1-ЗАМІЩЕНОГО-5-ФТОР-2-ОКСОПІРИМІДИНОН-1-(2Н)-КАРБОКСАМІДУ

(57) Реферат:

Винахід стосується N1-заміщених 5-фтор-2-оксопіримідинон-1-(2Н)-карбоксамідів і їх похідних, і застосування цих сполук як фунгіцидів.

UA 107671 C2

Передресні посилання на спорідненні заявки

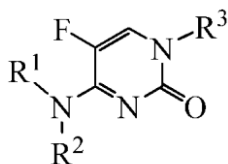
Дана заявка претендує на пріоритет попередньої заявки на патент США № 61/232245, поданої 7 серпня 2009 року.

Передумови і суть винаходу

5 Фунгіциди є сполуками природного або синтетичного походження, дія яких приводить до захисту від і/або усунення шкоди, яку заподіюють рослинам грибки, що мають відношення до сільськогосподарських культур. Як правило, один і той же фунгіцид не застосовний у всіх обставинах. Тому постійно проводяться дослідження з розробки фунгіцидів, які можуть мати вищу ефективність, зручніші у застосуванні і мають меншу вартість.

10 Даний винахід стосується похідних N1-заміщеного 5-фтор-2-оксопіримідинон-1(2H)-карбоксаміду і їх застосування як фунгіцидів. Сполуки за даним винаходом можуть забезпечити захист від аскоміцетів, базидіоміцетів, дейтеромицетів і ооміцетів.

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



15 Формула I,
де R¹ являє собою:
H;

C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁴;

C₂-C₆ алкеніл, необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁴;

20 C₃-C₆ алкініл, необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁴;

феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 фрагментами R⁵, або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3

фрагментами R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

-C(=S)R⁸;

30 -C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; або

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

35 де m означає ціле число від 1 до 3;

R² являє собою H або C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений R⁴;

як альтернатива, R¹ і R² можуть спільно утворювати фрагмент =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

R³ означає -C(=O)N(R⁹)R¹⁰ або -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

40 R⁴ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ галогеналкокси, C₁-C₄ алкілтіо, C₁-C₄ галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C₁-C₃ алкіламіно, C₂-C₆ алкоксикарбоніл, C₂-C₆ алкілкарбоніл, C₂-C₆ алкіламінокарбоніл, гідроксил або C₃-C₆ триалкілсиліл;

R⁵ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ галогеналкокси, C₁-C₆ алкілтіо, C₁-C₆ галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C₁-C₆ алкіламіно, C₂-C₆ діалкіламіно, C₂-C₆ алкоксикарбоніл або C₂-C₆ алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

45 R⁶ означає H, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ алкокси, бензил або феніл, де кожний із вказаних бензилу і фенілу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵;

50 R⁷ означає H, C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₃-C₆ алкініл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₁-C₆ алкоксилалкіл, C₂-C₆ алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵ або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

R^8 означає Н, C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_3-C_6 алкініл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або

конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 фрагментами R^5 ;

R^9 означає Н, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксіалкіл, C_1-C_6 алкілалкоксикарбоніл, C_2-C_6 алкілкарбоніл, $-(CH_2)_mSCH_3$, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 фрагментами R^5 ;

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

як альтернатива, R^9 і R^{10} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ;

R^{11} означає Н або C_1-C_4 алкіл;

R^{12} означає Н, ціано, гідроксил, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_2-C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 фрагментами R^5 ;

як альтернатива, R^{11} і R^{12} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ;

R^{13} означає Н, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_2-C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ; і

як альтернатива, R^{12} і R^{13} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 .

Інший варіант здійснення даного винаходу може включати фунгіцидну композицію для боротьби з грибовим ураженням або запобігання цьому ураженню, що включає описані нижче сполуки і фітологічно прийнятний носій.

Ще один варіант здійснення даного винаходу може включати спосіб боротьби з ураженням рослин грибами або запобігання цьому ураженню, де вказаний спосіб включає стадії нанесення фунгіцидно-ефективної кількості однієї або декількох описаних нижче сполук на щонайменше один з грибків, рослину, область, прилеглу до рослини, і насіння, що застосовується для одержання рослин.

Термін «алкіл» стосується розгалуженого, нерозгалуженого або циклічного вуглецевого ланцюга, включаючи метил, етил, пропіл, бутіл, ізопропіл, ізобутіл, третинний бутіл, пентил, гексил, циклопропіл, циклобутіл, циклопентил, циклогексил і т. п.

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

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

У тексті даної заявки термін «R» стосується групи, що складається з C_{2-8} алкілу, C_{3-8} алкенілу або C_{3-8} алкінілу, якщо не вказано інше.

Термін «алкокси» стосується замісника -OR.

Термін «алкоксикарбоніл» стосується замісника -C(O)-OR.

Термін «алкілкарбоніл» стосується замісника -C(O)-R.

Термін «алкілсульфоніл» стосується замісника -SO₂-R.

Термін «галогеналкілсульфоніл» стосується замісника -SO₂-R, де R повністю або частково заміщений атомами Cl, F, I або Br, або будь-якою їх комбінацією.

Термін «алкілтіо» стосується замісника -S-R.

Термін «галогентіо» стосується сірки, заміщеної трьома або п'ятьма атомами F.

Термін «галогеналкілтію» стосується алкілтію, який заміщений атомами 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 «алкілалкоксикарбоніл» стосується замісника $-(CH_2)_mC(O)OR$.

Термін «алкілциклоалкіламіно» стосується циклоалкіламіно замісника, який заміщений алкільною групою.

Термін «триалкілсиліл» стосується групи $-SiR_3$.

Термін «ціано» стосується замісника $-C\equiv N$.

10 Термін «гідроксил» стосується замісника $-OH$.

Термін «аміно» стосується замісника $-NH_2$.

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

Термін «діалкіламіно» стосується замісника $-NR_2$.

15 Термін «алкоксіалкокси» стосується групи $-O(CH_2)_nO(CH_2)_mCH_3$, де n означає 1-3, і m означає 0-2.

Термін «алкоксіалкіл» стосується алкілу, заміщеного алкоксигрупою.

Термін «галогеналкоксіалкіл» стосується алкілу, заміщеного алкоксигрупою, яка повністю або частково заміщена атомами Cl, F, Br або I, або будь-якою їх комбінацією.

Термін «гідроксіалкіл» стосується алкілу, який заміщений гідроксильною групою.

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

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

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

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

Терміни «галоген» або «гало» стосуються одного або декількох атомів галогенів, до числа яких входять F, Cl, Br і I.

30 Термін «гідроксикарбоніл» стосується замісника $-C(O)-OH$.

Термін «нітро» стосується замісника $-NO_2$.

35 Потрібно розуміти, що у всьому тексті заявки згадування сполук формули (I) включає також оптичні ізомери і солі сполук формули (I), а також їх гідрати. Конкретно, якщо сполука формули (I) містить розгалужену алкільну групу, передбачається, що така сполука включає оптичні ізомери і їх рацемічні суміші. До числа типових солей належать: гідрохлориди, гідроброміди, гідродіодиди і т. п. Крім того, сполуки формули (I) можуть включати таутомерні форми.

40 Деякі зі сполук, розкритих у даній заявці, можуть існувати у формі одного або декількох ізомерів. Фахівець у даній галузі зрозуміє, що один ізомер може бути більш активний, ніж інші. Структури, розкриті у даній заявці, для ясності викладення зображені тільки в одній геометричній формі, але вона служить для представлення всіх геометричних і таутомерних форм молекули.

45 Крім того, фахівець у даній галузі розуміє, що допустиме включення у молекулу додаткових замісників, якщо не вказано інше і якщо при цьому не порушуються правила утворення хімічних зв'язків, не виникає надмірна енергія деформації, і продукт як і раніше зберігає фунгіцидну активність.

Інший варіант здійснення даного винаходу стосується застосування сполук формули (I) для захисту рослин від ураження фітопатогенними мікроорганізмами або для обробки рослин, інфікованих фітопатогенними мікроорганізмами, включаючи нанесення сполуки формули (I) або композиції, що включає цю сполуку, на ґрунт, рослину, частину рослини, листя і/або насіння.

50 Крім того, ще один варіант здійснення даного винаходу стосується композиції, застосовної для захисту рослин від ураження фітопатогенними мікроорганізмами і/або для обробки рослин, інфікованих фітопатогенними мікроорганізмами, що включають сполуку формули (I) і фітологічно прийнятний носій.

55 Інші відмітні особливості і переваги даного винаходу стануть зрозумілі фахівцеві у даній галузі при ознайомленні з наведеним нижче докладним описом ілюстративних варіантів здійснення винаходу, які служать прикладами найкращих шляхів реалізації винаходу, як вони розуміються у даний час.

Докладний опис винаходу

60 Сполуки за даним винаходом можна застосовувати будь-яким з ряду відомих способів, або у формі самих сполук, або у формі складів, що включають ці сполуки. Наприклад, сполуки можна

наносити на коріння, насіння або листя рослин для боротьби з різними грибками, без шкоди для комерційної цінності рослин. Ці речовини можна наносити у формі будь-якого з широко застосовуваних типів складів, наприклад, у вигляді розчинів, дустів, порошків, що змочуються, текучих або сипких концентратів або концентратів, що емульгуються.

5 Переважно сполуки за даним винаходом застосовують у формі складів, що включають одну або декілька сполук формули (I) нарівні з фітологічно прийнятним носієм. Концентровані склади з метою нанесення можна диспергувати у воді або інших рідинах, або ж склади можуть мати форму дусту або гранул, які можна потім застосовувати без додаткової обробки. Ці склади можна одержувати за методиками, які є традиційними у галузі сільськогосподарської хімії.

10 Даний винахід охоплює всі носії, за допомогою яких одну або декілька сполук за даним винаходом можна перетворити у склади для доставки і застосування як фунгіциду. Як правило, склади наносять у формі водних суспензій або емульсій. Ці суспензії або емульсії можуть бути одержані з розчинних у воді, таких, що суспендуються у воді, або таких, що емульгуються, складів, які є твердими речовинами, звичайно відомими як порошки, що змочуються; або рідин, які звичайно відомі як концентрати, що емульгуються, водні суспензії або концентрати суспензій. Легко зрозуміти, що є можливість застосовувати будь-які речовини, до яких можна додавати ці сполуки, за умови забезпечення бажаних корисних властивостей, без значного негативного впливу на активність цих сполук як протигрибкових засобів.

20 Порошки, що змочуються, які можна спресувати у форму гранул, що диспергуються у воді, включають однорідну суміш однієї або декількох сполук формули (I), інертного носія і поверхнево-активних речовин. Концентрація сполуки у порошок, що змочується, може складати від приблизно 10 до приблизно 90 мас.% від загальної маси порошку, що змочується, більш переважно від приблизно 25 до приблизно 75 мас.%. При одержанні порошків, що змочуються, сполуки можна змішати з будь-якою тонкоподрібненою твердою речовиною, наприклад, пірофілітом, тальком, крейдою, гіпсом, фулеровою землею, бентонітом, атапульгітом, крохмалем, казеїном, глютенном, монтморилонітовими глинами, діатомовою землею, очищеними силікатами і т. п. Для одержання таких сумішей тонкоподрібнений носій і поверхнево-активні речовини, як правило, змішують зі сполукою (сполуками) і розмелюють.

30 Концентрати, що емульгуються, сполук формули (I) можуть включати сполуку у стандартній концентрації, наприклад, від приблизно 10 до приблизно 50 мас.% від загальної маси концентрату, у придатній рідині. Сполуки можуть бути розчинені в інертному носії, який являє собою або розчинник, що змішується з водою, або суміш органічних розчинників, що не змішуються з водою, і емульгаторів. Ці концентрати можна розбавляти водою або маслом з одержанням сумішей для розпилення у формі емульсій масло-у-воді. Застосовні органічні розчинники включають ароматичні сполуки, зокрема, висококиплячі нафталінові і олефінові фракції нафти, наприклад, важкі ароматичні продукти нафтоперегонки. Крім того, можуть застосовуватися інші органічні розчинники, наприклад, терпенові розчинники, включаючи продукти, одержані зі смоли, аліфатичні кетони, наприклад, циклогексанон і складні спирти, наприклад, 2-етоксіетанол.

40 Фахівець у даній галузі може легко визначити емульгатори, які можна з успіхом застосовувати у складах за даним винаходом, і до їх числа входять різні неіонні, аніонні, катіонні і амфотерні емульгатори або суміші двох або декількох емульгаторів. Приклади неіонних емульгаторів, застосованих при одержанні концентратів, що емульгуються, включають прості ефіри поліалкіленгліколів і продукти конденсації алкіл і арил фенолів, аліфатичних спиртів, аліфатичних амінів або жирних кислот з етиленоксидом, пропіленоксидами, як, наприклад, етоксіловані алкілфеноли і складні ефіри карбонових кислот, солюбілізовані поліолами або поліоксіалкіленами. Катіонні емульгатори включають четвертинні амонієві сполуки і солі амінів жирного ряду. Аніонні емульгатори включають маслорозчинні солі (наприклад, кальцієві) арилалкілсульфонових кислот, маслорозчинні солі сульфатованих простих ефірів полігліколів і придатні солі фосфатованих простих ефірів полігліколів.

50 Типовими рідкими органічними продуктами, які можна застосовувати при одержанні концентратів, що емульгуються, сполук за даним винаходом, є рідкі ароматичні сполуки, наприклад, ксилол, фракції пропілбензолу або змішані нафталінові фракції, мінеральні масла, заміщені ароматичні рідкі продукти, наприклад, діоктилфталат; газ; діалкіламіди різних жирних кислот, зокрема диметиламіди жирних гліколів і похідних гліколів, наприклад, н-бутиловий ефір, етиловий ефір або метиловий ефір діетиленгліколю і метиловий ефір триетиленгліколю і т. п. Суміші двох або декількох органічних рідин також можна застосовувати при одержанні концентрату, що емульгується. Рідкі органічні продукти включають ксилол і фракції пропілбензолу, причому ксилол у деяких випадках є найбільш переважним. У рідких складах, як правило, застосовуються поверхнево-активні диспергуючі засоби, і їх кількість складає від 0,1

до 20 мас.% від загальної маси диспергуючого агента, що включає одну або декілька сполук. Склади за даним винаходом можуть містити також інші сумісні домішки, наприклад, регулятори росту рослин або інші біологічно активні сполуки, що застосовуються у сільському господарстві.

Водні суспензії включають суспензії однієї або декількох нерозчинних у воді сполук формули (I), диспергованих у водному носії у концентрації, що знаходиться у діапазоні від приблизно 5 до приблизно 50 мас.% від загальної маси водної суспензії. Суспензії одержують шляхом тонкого подрібнення однієї або декількох сполук за даним винаходом і енергійного змішування діючої речовини з носієм, що складається з води і поверхнево-активних компонентів, вибраних з типів, що обговорювалися вище. Крім того, для збільшення густини і в'язкості водного носія, можна додавати інші компоненти, наприклад, неорганічні солі і синтетичні або природні смоли. Часто найбільш ефективним виявляється здійснювати розтирання і змішування одночасно, одержуючи водну суміш і проводячи її гомогенізацію у такому пристрої, як, наприклад, пісочний млин, кульовий млин або змішувач поршневого типу.

Водні емульсії включають емульсії одного або декількох нерозчинних у воді пестицидно-активних інгредієнтів, емульгованих у водному носії у концентрації, що знаходиться у діапазоні від приблизно 5 до приблизно 50 мас.% від загальної маси водної емульсії. Якщо пестицидно-активний інгредієнт є твердою речовиною, перед одержанням водної емульсії його необхідно розчинити у придатному розчиннику, що не змішується з водою. Емульсії одержують емульгуванням рідкого пестицидно-активного інгредієнта або його розчину, що не змішується з водою, у водному середовищі, як правило, з доданням вказаних вище поверхнево-активних речовин, які сприяють утворенню і стабілізації емульсії. Часто це здійснюють за допомогою енергійного змішування, яке проводять за допомогою міксерів або змішувачів з високим зсувним зусиллям.

Сполуки формули (I) можна також застосовувати у вигляді гранульованих складів, які особливо підходять для нанесення на ґрунт. Гранульовані склади, як правило, містять від приблизно 0,5 до приблизно 10 мас.% сполуки (сполук) від загальної маси гранульованого складу, де сполуки дисперговані в інертному носії, який повністю або здебільшого складається з грубо розмеленого інертного матеріалу, такого як атапульгіт, бентоніт, діатоміт, глина або аналогічна недорога речовина. Ці склади звичайно одержують розчиненням сполук у придатному розчиннику і нанесенням розчину на гранульований носій, який заздалегідь подрібнений до частинок придатного розміру у межах від приблизно 0,5 до приблизно 3 мм. Придатним розчинником є розчинник, в якому сполука розчинна повністю або значною мірою. Ці склади можна одержувати також виготовляючи тісто або пасту з носія, сполуки і розчинника з подальшим висушуванням і дробленням з одержанням бажаних частинок у формі гранул.

Дусти, що містять сполуки формули (I), можна одержувати ретельним змішуванням однієї або декількох сполук за даним винаходом у порошкоподібній формі з придатним для застосування у сільському господарстві тонкоподрібненим носієм, наприклад, каоліновою глиною, подрібненою вулканічною породою і т. п. Придатний вміст сполук за даним винаходом у дустах може складати від приблизно 1 до приблизно 10 мас.% від загальної маси дусту.

Склади за даним винаходом можуть додатково містити допоміжну поверхнево-активну речовину для поліпшення відкладання, змочування і проникнення сполук у цільові культури і мікроорганізми. Ці допоміжні поверхнево-активні речовини можуть на вибір застосовуватися як компонент складу або додаватися у змішувальну ємність. Кількість допоміжної поверхнево-активної речовини, як правило, знаходиться у межах від 0,01 до 1,0 об.% від об'єму води, що розпилюється, переважно від 0,05 до 0,5 об.%. Придатні допоміжні поверхнево-активні речовини включають, не обмежуючись цим, етоксировані нонілфеноли, етоксировані синтетичні або природні спирти, солі ефірів сульфобурштинових кислот, етоксировані органосилікони, етоксировані жирні аміни і суміші поверхнево-активних речовин з мінеральними маслами або рослинними оліями. Склади можуть також включати емульсії масло-у-воді, наприклад, розкриті у заявці на патент США з порядковим номером 11/495228, зміст якої включений у дану заявку за допомогою посилання.

Склади за даним винаходом можуть необов'язково включати комбінації, які містять інші пестицидні сполуки. Ці додаткові пестицидні сполуки можуть являти собою фунгіциди, інсектициди, гербіциди, нематодциди, мітициди, артроподициди, бактерициди або їх комбінації, які сумісні зі сполуками за даним винаходом у середовищі, вибраному для застосування, і не протидіють активності сполук за даним винаходом. Відповідно, у цих варіантах здійснення інші пестицидні сполуки застосовують як додаткові токсичні речовини, з метою знищення тих самих або інших шкідників рослин. Сполуки формули (I) і пестицидна сполука у вказаній комбінації, як правило, можуть бути присутніми у масовому співвідношенні від 1:100 до 100:1.

Сполуки за даним винаходом можна також комбінувати з іншими фунгіцидами з одержанням фунгіцидних сумішей і синергетичних сумішей фунгіцидів. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом часто застосовують у поєднанні з одним або декількома іншими фунгіцидами для боротьби з більш широким колом небажаних захворювань. При застосуванні у поєднанні з

5 іншим фунгіцидом (іншими фунгіцидами), сполуки за даною заявкою можуть бути включені в один склад з іншим фунгіцидом (іншими фунгіцидами), змішані в ємності з іншим фунгіцидом (іншими фунгіцидами) або застосовані послідовно з іншим фунгіцидом (іншими фунгіцидами). Згадані інші фунгіциди можуть включати 2-(тіоціанатометилтіо)-бензотіазол, 2-фенілфенол, 8-гідроксигінолін сульфат, аметоктрадин, амисулбром, антимицин, *Ampelomyces quisqualis*,

10 азаконазол, азоксистробін, *Bacillus subtilis*, штам *Bacillus subtilis* ZAT713, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб-ізопропіл, бензиламінобензол-сульфонатні солі (BABS), бікарбонати, біфеніл, бісмертіазол, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, боракс, бордоську суміш, боскалід, бромуконазол, бупіримат, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, класафенон, хлоронеб, хлорталоніл, клозолінат, *Coniothyrium minitans*,

15 гідроксид міді, октаноат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, сульфат міді (трехосновний), оксид міді(І), ціазофамід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дебакарб, етиленбіс-(дитіокарбамат) діамонію, дихлофлуанід, дихлорфен, диклоцимет, дикломезин, дихлоран, діетофенкарб, дифеноконазол, дифензокват іон, дифлуметорим, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динобутон, динокап, дифеніламін, дитіанон,

20 додеморф, додеморфу ацетат, додин, додин у формі вільної основи, едифенфос, енестробін, епоксиконазол, етабоксам, етоксиквін, етридазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, фентин, фентину ацетат, фентину гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуморф, флуопіколід, флуопірам, фторімід, флуоксастробін, флуквінказол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, формальдегід, фосетил, фосетил-алюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гуазатину ацетати, GY-81, гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазаліл, імазалілу сульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадину триацетат, іміноктадину трис(албесилат), йодокарб, іпконазол, іпфенпіразолон, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан,

30 ізопіразам, ізотіаніл, касугаміцин, гідрат касугаміцину гідрохлориду, крезоксим-метил, ламінарин, манкопер, манкозеб, мандипропамід, манеб, мепаніпірим, мепроніл, мептил-динокап, хлорид ртуті(ІІ), оксид ртуті(ІІ), хлорид ртуті(І), металаксил, мефеноксам, металаксил-М, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, метконазол, метасульфоккарб, метилйодид, метилізотіоціанат, метирам, метоміностробін, метрафенон, мілдіоміцин, міклобутаніл, набам, нітротал-ізопропіл, нуаримол, октилінон, офурац, олеїнову кислоту (жирні кислоти), орисастробін, оксидиксил, оксин-мідь, окспоконазолу фумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентахлорфеніл лаурат, пентіопірад, фенілртуті ацетат, фосфонову кислоту, фталід, піоксиксиробін, поліоксин В, поліоксини, поліоксорим, бікарбонат калію, гідроксигінолінсульфат калію, пробеназол, прохлораз,

40 процимідон, пропамокарб, пропамокарбу гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, проквіназид, протіоконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксиксиробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутикарб, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, піроквілон, квінокламін, квіноксефін, квінтозен, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, седаксан, силтіофам, симеконазол, натрію 2-фенілфеноксид, бікарбонат натрію, пентахлорфеноксид натрію, спіроксамін, сірку, SYP-Z071, SYP-Z048, кам'яновугільні масла, тебуконазол, тебуфлуквін, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксиробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, валідаміцин, валіфеналат, валіфенал, вінклозолін, цинеб, зирам, зоксамід, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma* spp., (RS)-N-(3,5-дихлорфеніл)-2-(метокси-метил)сукцинімід, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлор-1,1,3,3-тетрафторацетону гідрат, 1-хлор-2,4-динітронафталін, 1-хлор-2-нітропропан, 2-(2-гептадецил-2-імідазолін-1-іл)етанол, 2,3-дигідро-5-феніл-1,4-дитііну 1,1,4,4-тетраоксид, 2-метоксіетилртуті ацетат, 2-метоксіетилртуті хлорид, 2-метоксіетилртуті силікат, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 4-(2-нітропроп-1-еніл)феніл тіоціанат,

50 ампропілфос, анілазин, азитирам, полісульфід барію, Bayer 32394, беноданіл, бенквінокс, бенталурон, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бінамакріл, біс(метилртуті)сульфат, біс(трибутилолова)оксид, бутіобат, кадмію кальцію міді цинку хромат сульфат, карбаморф, СЕСА, клобенітазон, хлораніформетан, хлорфеназол, хлорквінокс, клімбазол, циклафурамід, ципендазол, ципрофурам, декафентин, дихлон, дихлозолін,

60 диклобутразол, диметиримол, диноктон, диносальфон, динотербон, дипіритіон, диталімфос,

додицин, дразоксолон, ЕВР, ЕSBP, етаконазол, етем, етирим, фенаміносульф, фенапаніл, фенітропан, 5-фторцитозин і його профунгіциди, флуотримазол, фуркарбаніл, фурконазол, цис-фурконазол, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофульвін, галакринат, Hercules 3944, гексилтіофос, ICIA0858, ізопамфос, ізоваледіон, мебеніл, мекарбінзид, метазоксолон, метфуроксам, метилртуті диціандіамід, метсульфовакс, мілнеб, мукохлорний ангідрид, міклозолін, N-3,5-дихлорфенілсукцинімід, N-3-нітрофенілітаконімід, натаміцин, N-етилртуть-4-толуолсульфонанілід, нікелю біс(диметилдитіокарбамат), OCH, фенілртуті диметилдитіокарбамат, фенілртуті нітрат, фосдифен, піколінамід UK-2A і його похідні, протіокарб, протіокарбу гідрохлорид, піракарболід, піридинітрил, піроксихлор, піроксифур, квінацетол, квінацетолу сульфат, квіназамід, квінконазол, рабензазол, саліциланілід, SSF-109, сультропен, текорам, тіадифтор, тиціофен, тіохлорфенфім, тіофанат, тіоквінокс, тіоксимід, триаміфос, триаримол, триазбутил, трихламід, урбацід і зариламід, а також будь-які їх комбінації.

Крім того, сполуки за даним винаходом можна комбінувати з іншими пестицидами, у тому числі інсектицидами, нематоцидами, мітицидами, артроподицидами, бактерицидами або їх комбінаціями, які сумісні зі сполуками за даним винаходом у середовищі, вибраному для застосування, і не протидіють активності сполук за даним винаходом для утворення сумішей пестицидів і їх синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом можуть застосовуватися у поєднанні з одним або декількома іншими пестицидами для боротьби з більш широким колом небажаних шкідників рослин. При застосуванні у поєднанні з іншими пестицидами, сполуки за даним винаходом можуть бути включені в один склад з іншим пестицидом (іншими пестицидами), змішані в ємності з іншим пестицидом (іншими пестицидами) або застосовані послідовно з іншим пестицидом (іншими пестицидами). Типові інсектициди включають, не обмежуючись перерахованими: інсектициди з числа антибіотиків, наприклад, алосамідин і турингієнзин; інсектициди з числа макроциклічних лактонів, наприклад, спіносад і спінеторам; авермектинові інсектициди, наприклад, абамектин, дорамектин, емамектин, еприномектин, івермектин і селамектин; мілбеміцинові інсектициди, наприклад, лепімектин, мілбемектин, мілбеміцину оксим і моксидектин; арсеновмісні інсектициди, наприклад, арсенат кальцію, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, арсенат свинцю, арсеніт калію і арсеніт натрію; інсектициди рослинного походження, наприклад, анабазин, азадирахтин, d-лімонен, нікотин, піретрини, цинерини, цинерин I, цинерин II, ясмолин I, ясмолин II, піретрин I, піретрин II, квасія, ротенон, ріанія і сабадила; карбаматні інсектициди, наприклад, бендіокарб і карбарил; бензофураніл метилкарбаматні інсектициди, наприклад, бенфуракарб, карбофуран, карбосульфат, декарбофуран і фураціокарб; диметилкарбаматні інсектициди, наприклад, димітан, диметилан, хіквінкарб і піримікарб; оксим карбаматні інсектициди, наприклад, аланікарб, алдікарб, альдоксикарб, бутоксикарб, бутоксикарбоксим, метоміл, нітрилакарб, оксаміл, тазимкарб, тіокарбоксим, тіодикарб і тіофанокс; фенілметилкарбаматні інсектициди, наприклад, аліксикарб, амінокарб, буфенкарб, бутаккарб, клоетокарб, дикрезил, діоксикарб, ЕМРС, етіофенкарб, фенетакарб, фенобукарб, ізопрокарб, метіокарб, метолкарб, мексаккарбат, промацил, промеккарб, пропексур, триметакарб, ХМС і ксилікарб; вологопоглинаючі інсектициди, наприклад, борну кислоту, діатомову землю і силікагель; діамідні інсектициди, наприклад, хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; динітрофенольні інсектициди, наприклад, динекс, динопроп, диносам і DNOC; фторвмісні інсектициди, наприклад, гексафторсилікат барію, кріоліт, фторид натрію, гексафторсилікат натрію і сульфлурамід; формамідинові інсектициди, наприклад, амітраз, хлордимеформ, форметанат і формпаранат; фумігантні інсектициди (для обкурювання), наприклад, акрилонітрил, дисульфід вуглецю, чотирьоххлористий вуглець, хлороформ, хлорпікрин, пара-дихлорбензол, 1,2-дихлорпропан, етилформіат, етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, ціанід водню, йодметан, метилбромід, метилхлороформ, хлористий метилен, нафталін, фосфін, сульфурілфторид і тетрахлоретан; неорганічні інсектициди, наприклад, боракс, полісульфід кальцію, олеат міді, хлорид ртуті (I), тіоціанат калію і тіоціанат натрію; інгібітори синтезу хітину, наприклад, бістрифлурон, бупрофензин, хлорфлуазурон, циромазин, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлумурон, пенфлурон, тефлубензурон і трифлумурон; імітатори ювенільних гормонів, наприклад, епофенонан, феноксикарб, гідропрен, кінопрен, метопрен, пірипроксибен і трипрен; ювенільні гормони, наприклад, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II і ювенільний гормон III; агоністи гормонів линяння, наприклад, хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид і тебуфенозид; гормони линяння, наприклад, α-екдизон і екдистерон; інгібітори линяння, наприклад, діофенолан; прекоцени, наприклад, прекоцен I, прекоцен II і прекоцен III; регулятори росту комах, які не належать до визначеного класу, наприклад, дицикланіл; інсектициди, що є

аналогами нереїстоксину, наприклад, бенсультап, картап, тіоциклам і тіосультап; нікотинοїдні інсектициди, наприклад, флонікамід; нітрогуанідинові інсектициди, наприклад, клотіанідин, динотефуран, імідаклоприд і тіаметоксам; нітромаєтиленові інсектициди, наприклад, нітенпірам і нітіазин; піридилметиламінові інсектициди, наприклад, ацетаміприд, імідаклоприд, нітенпірам і

5 тіаклоприд; хлорорганічні інсектициди, наприклад, бром-DDT, камфехлор, DDT, pp'-DDT, етил-DDD, HCH, гамма-HCH, ліндан, метоксихлор, пентахлорфенол і TDE; циклодієнові інсектициди, наприклад, алдрин, бромциклен, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, дієлдрин, дилор, ендосульфан, альфа-ендосульфан, ендрин, HEOD, гептахлор, HHDN, ізобензан, ізодрин, келеван і мірекс; орґанофосфатні інсектициди, наприклад, бромфєнвінфос, хлорфєнвінфос,

10 кротоксифос, дихлорвос, дикротофос, диметилвінфос, фоспірат, гептєнофос, метокротофос, мєвінфос, монокротофос, налед, нафталофос, фосфамідон, пропафос, TEPР і тетрахлорвінфос; орґанотіофосфатні інсектициди, наприклад, діоксабензофос, фосметилан і фєнтоат; інсектициди з числа аліфатичних орґанотіофосфатів, наприклад, ацетіон, амітон, кадузафос, хлорєтоксифос, хлормєфос, демєфіон, демєфіон-О, демєфіон-S; демєтон,

15 демєтон-О, демєтон-S, демєтон-мєтил, демєтон-О-мєтил, демєтон-S-мєтил, демєтон-S-мєтилсульфон, дисульфотон, єтіон, єтопрофос, IPSP, ізотіоат, малатіон, метакрифос, оксидемєтон-мєтил, оксидєпрофос, оксидисульфотон, форат, сульфотєп, тербуфос і тіомєтон; інсектициди з числа аліфатичних амідів орґанотіофосфатів, наприклад, амідітєн, ціантоат, димєтоат, єтоат-мєтил, формотіон, мєкарбам, ометоат, протоат, софамід і вамідотіон;

20 інсектициди з числа оксимів орґанотіофосфатів, наприклад, хлорфоксим, фоксим і фоксим-мєтил; інсектициди з числа гєтєроциклічних орґанотіофосфатів, наприклад, азамєтифос, коумафос, коумітоат, діоксатіон, єндотіон, мєназон, морфотіон, фосалон, піраклофос, піридафєнтіон і хінотіон; інсектициди з числа бензотіопіран орґанотіофосфатів, наприклад, дитикрєфос і тикрєфос; інсектициди з числа бензотріазин орґанотіофосфатів, наприклад,

25 азінфос-єтил і азінфос-мєтил; інсектициди з числа ізοіндол орґанотіофосфатів, наприклад, діаліфос і фосмєт; інсектициди з числа ізоксазол орґанотіофосфатів, наприклад, ізоксатіон і золапрофос; інсектициди з числа піразолопіримідин орґанотіофосфатів, наприклад, хлорпразєфос і піразєфос; інсектициди з числа піридин орґанотіофосфатів, наприклад, хлорпірифос і хлорпірифос-мєтил; інсектициди з числа піримідин орґанотіофосфатів,

30 наприклад, бутатієфос, діазинєн, єтримфос, ліримфос, піриміфос-єтил, піриміфос-мєтил, піримідофос, піримітат і тєбупіримфос; інсектициди з числа хіноксалін орґанотіофосфатів, наприклад, хіналфос і хіналфос-мєтил; інсектициди з числа тіадіазол орґанотіофосфатів, наприклад, атидатіон, літідатіон, мєтідатіон і протидатіон; інсектициди з числа триазол орґанотіофосфатів, наприклад, ісазофос і триазєфос; інсектициди з числа фєніл орґанотіофосфатів, наприклад, азотоат, бромєфос, бромєфос-єтил, карбофєнотіон,

35 хлортієфос, ціанофос, цитіоат, дикаптіон, дихлєфєнтіон, єтафос, фамфур, фєнхлєрфос, фєнілєнотіон, фєнсульфєтотіон, фєнтіон, фєнтіон-єтил, гєтєрофос, йодфєнфос, мєсульфєнфос, паратіон, паратіон-мєтил, фєнкаптон, фосніхлєр, профєнофос, протієфос, сульпрофос, тємєфос, трихлєрмєтафос-3 і трифєнофос; фосфонатні інсектициди, наприклад, бутєнат і

40 трихлєрфєн; фосфонтіоатні інсектициди, наприклад, мєкарфєн; фєніл єтилфосфонотіоатні інсектициди, наприклад, фонофос і трихлєронат; фєніл фєнілфосфонотіоатні інсектициди, наприклад, ціанофєнфос, EPN і лєптофос; фосфорамідатні інсектициди, наприклад, круфємат, фєнаміфос, фостієтан, мєфосфєлан, фосфєлан і піримєтафос; фосфорамідотіоатні інсектициди, наприклад, ацєфат, ізєкарбофос, ізєфєнфос, ізєфєнфос-мєтил, мєтамідєфос і

45 пропєтамфос; фосфордіамідні інсектициди, наприклад, димєфєкс, мазидєкс, міпафєкс і шрадєн; оксадіазинєві інсектициди, наприклад, індєксакарб; оксадіазолінові інсектициди, наприклад, мєтоксадіазєн; фталімідні інсектициди, наприклад, діаліфос, фосмєт і тєтрамєтрин; піразольні інсектициди, наприклад, тєбуфєнпірад, толєфєнпірад; фєнілпіразольні інсектициди, наприклад, ацєтопрол, єтіпрол, фіпроніл, пірафлупрол, пірипрол і ваніліпрол; інсектициди з

50 числа складних єфірів пірєтроїдів, наприклад, акрінатрин, алєтрин, біоалєтрин, бартрин, біфєнтрин, бієтанємєтрин, циклєтрин, циклопротрин, цифлутрин, бєта-цифлутрин, цигалєтрин, гамма-цигалєтрин, лямбда-цигалєтрин, ципєрмєтрин, альфа-ципєрмєтрин, бєта-ципєрмєтрин, тєта-ципєрмєтрин, дзєта-ципєрмєтрин, цифєнєтрин, дєльтамєтрин, димєфлутрин, димєтрин, ємпєнтрин, фєнфлутрин, фєнпіритрин, фєнпропатрин, фєнвалєрат, єсфєнвалєрат, флєцитринат, флєвалінат, тау-флєвалінат, фурєтрин, іміпрєтрин, мєпєрфлутрин, мєтофлутрин, пєрмєтрин, біопєрмєтрин, транспєрмєтрин, фєнєтрин, пралєтрин, профлутрин, пірєсмєтрин, рєсмєтрин, біорєсмєтрин, цисмєтрин, тєфлутрин, тєралєтрин, тєтрамєтрин, тєтрамєтилфлутрин, тралємєтрин і транsfлутрин; інсектициди з

55 числа простих єфірів пірєтроїдів, наприклад, єтофєнпрокс, флєфєнпрокс, галфєнпрокс, прєтрифєнбут і силєфлєуєфєн; піридинамінові інсектициди, наприклад, флєфєнєрим і

60

піримідифен; інсектициди з числа піролів, наприклад, хлорфенапір; інсектициди з числа похідних тетрамової кислоти, наприклад, спіротетрамат; інсектициди з числа похідних тетронової кислоти, наприклад, спіромезифен; інсектициди з числа похідних тіосечовини, наприклад, діафентіурон; інсектициди з числа похідних сечовини, наприклад, флукофурон і

5 сулькофурон; і інсектициди, що не належать до визначених класів, наприклад, клозантел, нафтенат міді, кротамітон, EXD, феназафлор, феноксакрим, гідраметилнон, ізопротіолан, малонобен, метафлумізон, ніфлуридид, пліфенат, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, рафоксанід, сульфоксафлор, триаратен і триазамат, а також будь-які їх комбінації.

Крім цього, сполуки за даним винаходом можуть бути скомбіновані з гербіцидами, які сумісні

10 зі сполуками за даним винаходом у середовищі, вибраному для застосування, і не протидіють активності сполук за даним винаходом, для утворення сумішей пестицидів і їх синергічних сумішей. Фунгіцидні сполуки за даним винаходом можуть застосовуватися у поєднанні з одним або декількома гербіцидами для боротьби з широким колом небажаних рослин. При застосуванні у поєднанні з гербіцидами, сполуки за даним винаходом можуть бути включені в

15 один склад з гербіцидом (гербіцидами), змішані в ємності з гербіцидом (гербіцидами) або застосовані послідовно з гербіцидом (гербіцидами). Типові гербіциди включають, не обмежуючись перерахованими: амідні гербіциди, наприклад, алідохлор, бєфлубутамід, бензадокс, бензипрам, бромбутид, кафенстрол, CDEA, ципразол, диметенамід, диметенамід-Р, дифенамід, епроназ, етніпромід, фентразамід, флупоксам, фомесафен, галосафен,

20 ізокарбамід, ізоксабен, напропамід, напталам, петоксамід, пропізамід, хінонамід і тебутам; анілідні гербіциди, наприклад, хлоранокрил, цисанлід, кломеппроп, ципромід, дифлуфенікан, етобензанід, фенасулам, флуфенацет, флуфенікан, мефенацет, мефлуїдид, метаміфоп, моналід, напроанлід, пентанохлор, піколінафен і пропаніл; арилаланінові гербіциди, наприклад, бензоїлппроп, флампроп і флампроп-М; хлорацетанлідні гербіциди, наприклад, ацетохлор,

25 алахлор, бутахлор, бутенахлор, делахлор, діетатил, диметахлор, метазахлор, метолахлор, S-метолахлор, претилахлор, пропахлор, пропізохлор, принахлор, тербухлор, тієнілхлор і ксилахлор; сульфоналідні гербіциди, наприклад, бензофтор, перфлуїдон, піримісульфан і профлуазол; сульфонамідні гербіциди, наприклад, асулам, карбасулам, фенасулам і оризалін; тіоамідні гербіциди, наприклад, хлортіамід; гербіциди з числа антибіотиків, наприклад,

30 біланафос; гербіциди, похідні бензойної кислоти, наприклад, хлорамбен, дикамба, 2,3,6-ТВА і трикамба; гербіциди, похідні піримідинілоксибензойної кислоти, наприклад, біспірибак і піримінобак; гербіциди, похідні піримідинілтїобензойної кислоти, наприклад, піритїобак; гербіциди, похідні фталевої кислоти, наприклад, хлортал; гербіциди, похідні піколінової кислоти, наприклад, амінопіралід, клопіралід і піклорам; гербіциди, похідні хінолінкарбонової кислоти,

35 наприклад, хінклорак і хінмерак; арсеновмісні гербіциди, наприклад, какоділову кислоту, СМА, DSMA, гексафлурат, MMA, MAMA, MSMA, арсеніт калію і арсеніт натрію; бензоїлциклогександіонові гербіциди, наприклад, мезотріон, сулкотріон, тефурилтрїон і темботріон; бензофураніл алкілсульфонатні гербіциди, наприклад, бенфурезат і етофумезат; бензотїазольні гербіциди, наприклад, бензазолін; карбаматні гербіциди, наприклад, асулам,

40 карбоксазол, хлорпрокарб, дихлормат, фенасулам, карбутилат і тербукарб; карбанілатні гербіциди, наприклад, барбан, ВСПС, карбасулам, карбетамід, СЕРС, хлорбуфам, хлорпрофам, СРРС, десмедифам, фенїзофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, профам і свеп; циклогексеноксимові гербіциди, наприклад, алоксидим, бутроксидим, клетодим, клопроксидим, циклоксидим, профоксидим, сетоксидим, тепралоксидим і тралкоксидим; гербіциди, похідні

45 циклопропілізоксазолу, наприклад, ізоксахлортол та ізоксафлутол; дикарбоксїмідні гербіциди, наприклад, цинїдон-етил, флумезин, флуміклорак, флуміоксазин і флуміпропін; динїтроанілінові гербіциди, наприклад, бенфлуралін, бутралін, динїтрамін, еталфлуралін, флухлоралін, ізопропалін, металпропалін, нїтралін, оризалін, пендиметалін, продіамін, профлуралін і трифлуралін; динїтрофенольні гербіциди, наприклад, динофенат, динопроп, диносам, диносеб,

50 динотерб, DNOC, етинофен і мединотерб; гербіциди, похідні дифенілового ефіру, наприклад, етоксифен; гербіциди, похідні нїтрофенілового ефіру, наприклад, ацифлуорфен, аклонїфен, біфенокс, хлометоксифен, хлорнїтрофен, етніпромід, фтордифен, фторглікофен, фторнїтрофен, фомесафен, фурилоксифен, галосафен, лактофен, нїтрофен, нїтрофлуорфен і оксифлуорфен; дитїокарбаматні гербіциди, наприклад, діазомет і метам; галогензаміщені алїфатичні гербіциди,

55 наприклад, алорак, хлорпон, далапон, флупропанат, гексахлорацетон, йодметан, метилбромід, монохлороцтову кислоту, SMA і TCA; імідазолїнонові гербіциди, наприклад, імазаметабенз, імазамокс, імазапїк, імазапїр, імазаквін і імазетапїр; неорганічні гербіциди, наприклад, сульфамат амонїю, боракс, хлорат кальцію, сульфат міді, сульфат залїза(II), азид калїю, цїанат калїю, азид натрію, хлорат натрію і сірчану кислоту; нїтрильні гербіциди, наприклад, бромбонїл,

60 бромксинїл, хлорксинїл, дихлобенїл, йодбонїл, іоксинїл і піраклонїл; фосфорорганічні гербіциди,

наприклад, аміпрофос-метил, анілофос, бенсулід, біланафос, бутаміфос, 2,4-DEP, DMPA, EBER, фосамін, глюфосинат, глюфосинат-Р, гліфосат і піперофос; фенокси гербіциди, наприклад, бромфеноксим, кломепроп, 2,4-DEB, 2,4-DEP, дифенопентен, дисул, ербон, етніпромід, фентеракол і трифопсим; оксадіазолінові гербіциди, наприклад, метазол, 5 оксадіаргіл, оксадіазон; оксазольні гербіциди, наприклад, феноксасульфен; феноксіоцтові гербіциди, наприклад, 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-тіоетил і 2,4,5-T; феноксимасляні гербіциди, наприклад, 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB і 2,4,5-TB; феноксипропіонові гербіциди, наприклад, клопроп, 4-CPР, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, 3,4-DP, фенопроп, мекопроп і мекопроп-Р; арилоксифеноксипропіонові гербіциди, наприклад, хлоразифоп, клодинафоп, 10 клофоп, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, феноксапроп-Р, фентіапроп, флуазифоп, флуазифоп-Р, галоксифоп, галоксифоп-Р, ізоксапірифоп, метаміфоп, пропаквізафоп, квізалофоп, квізалофоп-Р і трифоп; фенілендіамінові гербіциди, наприклад, динітрамін і продіамін; піразольні гербіциди, наприклад, піроксасульфен; бензоїлпіразольні гербіциди, наприклад, бензофенап, пірасульфотол, піразолінат, піразоксифен і топрамезон; 15 фенілпіразольні гербіциди, наприклад, флуазолат, ніпіраклофен, піксаден і пірафлуфен; піридазинові гербіциди, наприклад, кредазин, піридафол і піридат; піридазинові гербіциди, наприклад, бромпіразон, хлоридазон, димідазон, флуфенпір, метфлуразон, норфлуразон, оксапіразон і піданон; піридинові гербіциди, наприклад, амінопіралід, кліодинат, клопіралід, дитіопір, флуороксіпір, галоксидин, піклорам, піколінафен, піриклор, тіазопір і триклопір; 20 піримідиндіамінові гербіциди, наприклад, іпримідам і тіоклорим; гербіциди, похідні четвертинного амонію, наприклад, циперкват, діетамкват, дифензокват, дикват, морфамкват і паракват; тіокарбаматні гербіциди, наприклад, бутилат, циклоат, ді-алат, ЕРТС, еспрокарб, етіолат, ізополінат, метіобенкарб, молінат, орбенкарб, пебулат, просульфоккарб, пірибутикарб, сульфалат, тіобенкарб, тіокарбазил, три-алат і вернолат; тіокарбонатні гербіциди, наприклад, 25 димексано, EXD і проксан; гербіциди, похідні тіосечовини, наприклад, метіурон; триазинові гербіциди, наприклад, дипропетрин, індазифлам, триазифлам і тригідрокситриазин; хлортриазинові гербіциди, наприклад, атразин, хлоразин, ціаназин, ципразин, егліназин, іпазин, мезопразин, проціазин, прогліназин, пропазин, себутилазин, симазин, тербутилазин і триетазин; метокситриазинові гербіциди, наприклад, атратон, метометон, прометон, секбуметон, симетон і 30 тербуметон; метилтіотриазинові гербіциди, наприклад, аметрин, азіпротрин, ціанатрин, десметрин, диметаметрин, метопротрин, прометрин, симетрин і тербутрин; триазинонові гербіциди, наприклад, аметридін, амібозин, гексазинон, ізометіозин, метамітрон і метрибузин; триазольні гербіциди, наприклад, амітрол, кафенстрол, епроназ і флупоксам; триазолонові гербіциди, наприклад, амікарбазон, бенкарбазон, карфентразон, флукарбазон, іпфенкарбазон, 35 пропоксикарбазон, сульфентразон і тіенкарбазон-метил; триазолопіримідинові гербіциди, наприклад, клорансулам, диклосулам, флорасулам, флуметсулам, метосулам, пеноксулам і піроксулам; урацилові гербіциди, наприклад, бензфендизон, бромацил, бутафенацил, флупропацил, ізоцил, ленацил, сафлуфенацил і тербаціл; гербіциди, похідні сечовини, наприклад, бензтіазурон, кумілурун, циклурун, дихлоральсечовина, дифлуфензопір, ізонорурун, 40 ізоурун, метабензтіазурон, монісоурун і норурун; гербіциди, похідні фенілсечовини, наприклад, анісурун, бутурун, хлорбромурун, хлоретурун, хлортолурун, хлороксурун, діамурун, дифеноксурун, димефурун, діурун, фенурун, флуометурун, флуотіурун, ізопротурун, лінурун, метіурун, метилдимрун, метобензурун, метобромурун, метоксурун, монолінурун, монурун, небурун, парафлурун, фенобензурун, сидурун, тетрафлурун і тидіазурун; гербіциди, похідні 45 піримідинілсульфонілсечовини, наприклад, амідосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон, хлоримурун, циклосульфамурун, етоксисульфурон, флазасульфурон, флуцетосульфурон, флупірсульфурон, форамсульфурон, галосульфурон, імазосульфурон, мезосульфурон, метазосульфурон, нікосульфурон, ортосульфамурун, оксасульфурон, примісульфурон, пропірсульфурон, піразосульфурон, римсульфурон, сульфометурун, сульфосульфурон і 50 трифлорисульфурон; гербіциди, похідні триазинілсульфонілсечовини, наприклад, хлорсульфурон, циносульфурон, етаметсульфурон, йодсульфурон, метсульфурон, просульфурон, тифенсульфурон, триасульфурон, трибенурун, трифлусульфурон і тритосульфурон; гербіциди, похідні тіадіазолілсечовини, наприклад, бутіурун, етидимурун, тебутіурун, тіазафлурун і тидіазурун; і гербіциди, що не належать до визначених класів, наприклад, акролеїн, аліловий спирт, аміноциклопірахлор, азафенідин, бентазон, 55 бензобіциклон, біциклопірон, бутідазол, ціанамід кальцію, камбендихлор, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, цинметилін, кломазон, CPMF, крезол, ціанамід, орто-дихлорбензол, димепіперат, ендотал, фтормідин, флуридон, флуорохлоридон, флуортамон, флутіацет, інданофан, метилізотіоціанат, ОСН, оксазикломефон, пентахлорфенол,

пентоксазон, ацетат фенілртуті, просульфалін, пірибензоксим, пірифталід, квінокламін, родетаніл, сулглікапін, тидіазимін, тридифан, триметурон, трипропіндан і тритак.

Інший варіант здійснення даного винаходу стосується способу боротьби з ураженням рослин грибками або запобігання цьому ураженню. Цей спосіб включає нанесення на ґрунт, рослину, коріння, листя, насіння, осередок грибкового ураження або місце, де необхідно запобігти ураженню (наприклад, нанесення на посіви злаків або виноградники) фунгіцидно-ефективної кількості однієї або декількох сполук формули (I). Ці сполуки підходять для обробки різних рослин на фунгіцидно-ефективному рівні, проявляючи при цьому низьку фітотоксичність. Сполуки за даним винаходом можуть застосовуватися як засіб захисту і/або як засіб знищення.

Було виявлено, що сполуки за даним винаходом мають значний фунгіцидний ефект, зокрема, при застосуванні у сільському господарстві. Багато з цих сполук особливо ефективні для застосування на сільськогосподарських культурах і плодовоовочевих рослинах. Додаткова користь може полягати, але не обмежуватися цим, у поліпшенні здоров'я рослин; у поліпшенні продуктивності рослин (тобто збільшенні біомаси і/або підвищенні вмісту корисних інгредієнтів); у підвищенні сили росту рослин (тобто поліпшенні росту рослини і/або більш соковитому листі); у поліпшенні якості рослин (наприклад, у збільшенні кількості або поліпшенні якості визначених інгредієнтів); та у поліпшенні переносимості абіотичних і/або біотичних впливів на рослину.

Фахівець у даній галузі зрозуміє, що ефективність сполук проти вказаних вище грибків обумовлює загальну ефективність сполук за даним винаходом як фунгіцидів.

Сполуки за даним винаходом мають широкий діапазон ефективності проти грибкових патогенів. Типові патогени можуть включати, не обмежуючись цим, септоріозну плямистість листя пшениці (збудник *Septoria tritici*, відомий також як *Mycosphaerella graminicola*), паршу яблуні (збудник *Venturia inaequalis*), церкоспорозну плямистість листя цукрового буряка (збудник *Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (збудник *Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) та інших рослин, а також чорну сигаток бананів (збудник *Mycosphaerella fijiensis*). Точна кількість діючої речовини, яку потрібно застосовувати у тому або іншому випадку, залежить не тільки від конкретної застосовуваної діючої речовини, але також від конкретної бажаної дії, виду грибка, з яким ведеться боротьба, і стадії його росту, а також частини рослини або інших продуктів, які будуть контактувати зі сполукою. Таким чином, всі сполуки і склади, що містять їх, можуть мати неоднакову ефективність в одних і тих же концентраціях або проти одного і того ж виду грибків.

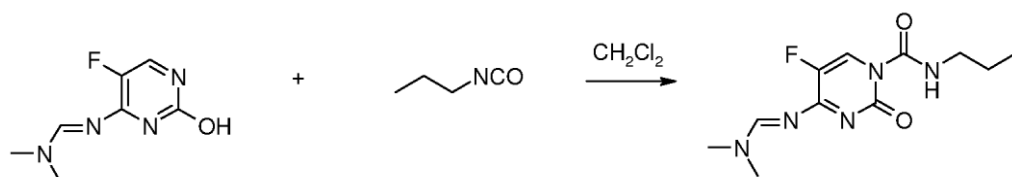
Сполуки за даним винаходом ефективні при застосуванні на рослинах у кількості, що придушує захворювання і є фітологічно прийнятною. Фраза «кількість, що придушує захворювання і є фітологічно прийнятною» стосується кількості сполуки, яка знищує або придушує хвороби рослин, боротьба з якими бажана, але не здійснює значної токсичної дії на рослину. Ця кількість, як правило, буде складати від приблизно 0,1 до приблизно 1000 ч./млн. (частин на мільйон), причому переважний діапазон від 1 до 500 ч./млн. Точна необхідна кількість сполуки змінюється в залежності від грибового захворювання, з яким ведеться боротьба, типу застосовуваного складу, способу нанесення, конкретного виду рослини, кліматичних умов і т. п. Доцільна норма застосування, як правило, знаходиться у діапазоні від приблизно 0,10 до приблизно 4 фунтів/акр (приблизно від 0,01 до 0,45 грамів на квадратний метр, г/м²).

Будь-який з наведених у заявці діапазонів або будь-яке бажане значення можуть бути розширені або змінені без втрати задуманого ефекту, що є очевидним для розуміння змісту даної заявки фахівцем у даній галузі.

Сполуки формули (I) можуть бути одержані з використанням добре відомих хімічних методик. Проміжні сполуки, які конкретно не згадані у тексті заявки, є або комерційно доступними, або можуть бути одержані способами, розкритими у хімічній літературі, або їх можна легко синтезувати з наявних у продажу вихідних речовин з використанням стандартних методик.

Наведені далі по тексту приклади надані для ілюстрації різних аспектів сполук за даним винаходом і їх не треба розглядати як обмеження обсягу формули винаходу.

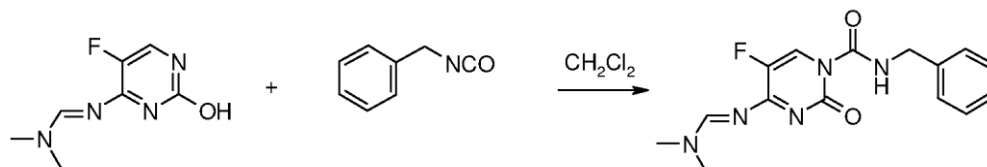
Приклад 1: Одержання пропіламіду 4-(диметиламінометиленаміно)-5-фтор-2-оксо-2Н-піримідин-1-карбонової кислоти (1)



У 7-мл флакон із загвинчуваною кришкою додавали дихлорметан (CH_2Cl_2 , 5 мл), N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідин (200 мг, 1,09 ммоль) і пропілізоціанат (94 мг, 1,10 ммоль). Суміш струшували при кімнатній температурі протягом 16 год. Після випарювання розчинника і перекристалізації неочищеного продукту з CH_2Cl_2 і гептану, виділяли вказану у заголовку сполуку у вигляді білої твердої речовини (274 мг, 94%): т. пл. 266-268°C; ^1H -ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 10,42 (ушир. с, 1H), 8,84 (с, 1H), 8,46 (д, J=6,6 Гц, 1H), 3,39-3,30 (м, 2H), 3,25 (с, 6H), 1,70-1,57 (м, 2H), 0,97 (т, J=7,4 Гц, 3H); ESI MC m/z 270 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

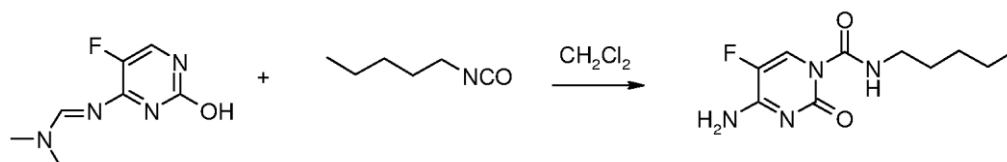
Сполуку 2 одержували за методикою прикладу 1.

Приклад 2: Одержання (Е)-N-бензил-4-((диметиламіно)метиленаміно)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксаміду (3)



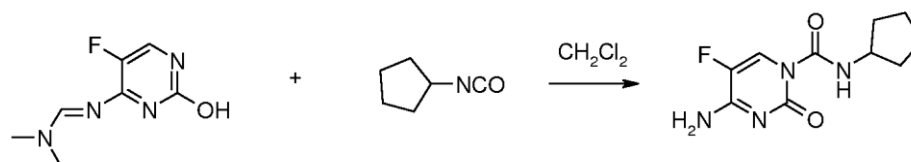
До суспензії N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідину (0,25 г, 1,35 ммоль) у CH_2Cl_2 (5 мл) додавали бензилізоціанат (0,187 мл, 1,49 ммоль), одержуючи розчин, який перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Суміш розбавляли CH_2Cl_2 (100 мл) і промивали насиченим розчином солі (2×50 мл). Об'єднані водні шари екстрагували CH_2Cl_2 (2×25 мл). Органічні екстракти висушували над сульфатом натрію (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували. Залишок очищали хроматографією на нормальній фазі (градієнт метанол/ CH_2Cl_2) і потім хроматографією на зворотній фазі (градієнт ацетонітрил (CH_3CN) у воді (H_2O)). Одержаний розчин концентрували при зниженому тиску, одержуючи осад. Суміш екстрагували CH_2Cl_2 (4×100 мл), висушували (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували, одержуючи (Е)-N-бензил-4-((диметиламіно)метиленаміно)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,268 г, 62%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 147-150°C; ^1H -ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 10,83 (т, J=4,94 Гц, 1H), 8,81 (с, 1H), 8,44 (д, J=6,59 Гц, 1H), 7,32-7,22 (м, 5H), 4,56 (д, J=5,93 Гц, 2H), 3,21 (с, 3H), 3,20 (с, 3H); ESI MC m/z 318,2 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Приклад 3: Одержання 4-аміно-5-фтор-2-оксо-N-пентилпіримідин-1(2H)-карбоксаміду (4)



До суспензії N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідину (0,25 г, 1,35 ммоль) у CH_2Cl_2 (5 мл) додавали пентилізоціанат (0,194 мл, 1,49 ммоль), одержуючи розчин, який перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Розчинник видаляли, одержуючи твердий залишок, який очищали хроматографією на зворотній фазі (градієнт $\text{CH}_3\text{CN}/\text{H}_2\text{O}$), одержуючи 4-аміно-5-фтор-2-оксо-N-пентилпіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,022 г, 6%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 289-292°C; ^1H -ЯМР (300 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 10,37 (д, J=6,59 Гц, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,32 (д, J=7,58 Гц, 1H), 8,18 (с, 1H), 4,03 (секстет, J=6,92 Гц, 1H), 1,94-1,85 (м, 2H), 1,68-1,39 (м, 6H); ESI MC m/z 241,2 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

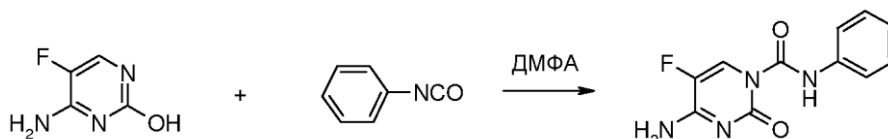
Приклад 4: Одержання 4-аміно-N-циклопентил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксаміду (5)



До суспензії N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформамідину (0,25 г, 1,35 ммоль) у CH_2Cl_2 (5 мл) додавали циклопентилізоціанат (0,168 мл, 1,49 ммоль), одержуючи розчин, який перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Розчинник видаляли, одержуючи твердий залишок, який очищали хроматографією на зворотній фазі (градієнт $\text{CH}_3\text{CN}/\text{H}_2\text{O}$), одержуючи 4-аміно-N-циклопентил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,018 г, 5%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 294-297°C; ^1H -ЯМР (300 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ

10,73 (д, J=6,59 Гц, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,32 (д, J=7,58 Гц, 1H), 8,18 (с, 1H), 4,03 (секстет, J=6,92 Гц, 1H), 1,94-1,85 (м, 2H), 1,68-1,39 (м, 6H); ESI MC m/z 239,1 ([M-H]).

Приклад 5: Одержання 4-аміно-5-фтор-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2H)-карбоксаміду (6)

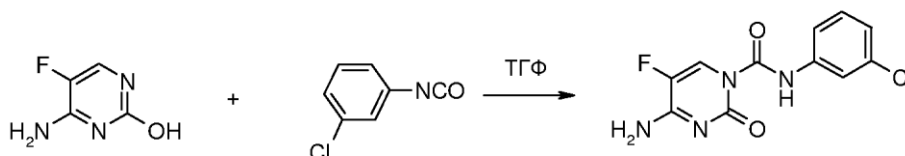


5 До суспензії 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу* (0,25 г, 1,94 ммоль) у сухому N,N-диметилформаміді (ДМФА, 5 мл) додавали фенілізоціанат (0,231 мл, 2,13 ммоль) і перемішували суміш при кімнатній температурі протягом 1 год. Суспензію фільтрували на вакуумній лійці і промивали діетиловим ефіром (Et₂O; 3×10 мл). Одержану тверду речовину висушували на повітрі протягом ночі, одержуючи 4-аміно-5-фтор-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,32 г, 66%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 275-277°C з розкладанням; ¹H-ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,81 (с, 1H), 8,63 (с, 1H), 8,43 (д, J=7,25 Гц, 1H), 8,35 (с, 1H), 7,55 (д, J=7,58 Гц, 2H), 7,37 (т, J=7,58 Гц, 2H), 7,13 (т, J=7,25 Гц, 1H); ESI MC m/z 247,1 ([M-H]).

* 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол можна придбати на ринку.

15 Сполуки 7-13 таблиці 1 синтезували за методикою прикладу 5.

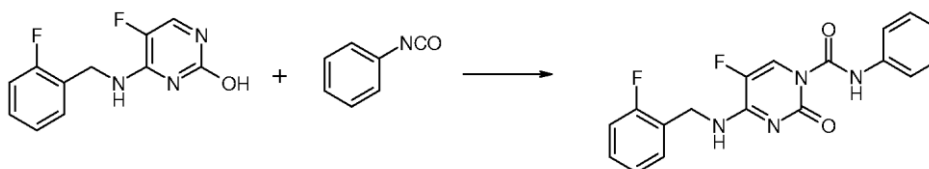
Приклад 6: Одержання 4-аміно-N-(3-хлорфеніл)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксаміду (14)



20 Використовуючи методику прикладу 5, але застосовуючи тетрагідрофуран (ТГФ) замість ДМФА як розчинник, здійснювали взаємодію 4-аміно-5-фторпіримідин-2-олу (0,25 г, 1,94 ммоль) і 3-хлорфеніл ізоціанату (0,260 мл, 2,13 ммоль), одержуючи 4-аміно-N-(3-хлорфеніл)-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,45 г, 82%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 250-252°C; ¹H-ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,82 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,43 (д, J=7,3 Гц, 1H), 8,35 (с, 1H), 7,29-7,20 (м, 2H), 7,06 (д, J=7,4 Гц, 1H), 6,71 (д, J=8,4 Гц, 1H); ESI MC m/z 280,9 ([M-H]).

25 Сполуки 15-27 таблиці 1 синтезували за методикою прикладу 6.

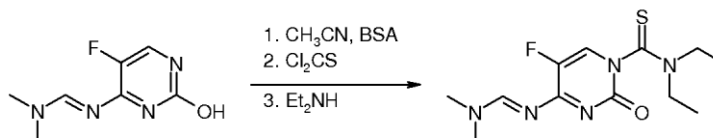
Приклад 7: Одержання 5-фтор-4-(2-фторбензиламіно)-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2H)-карбоксаміду (28)



30 У 25-мл флакон із загвинчуваною кришкою вміщували 5-фтор-4-(2-фторбензиламіно)піримідин-2-ол (74,3 мг, 0,313 ммоль), ТГФ (2 мл) та ізоціанатобензол (0,33 мл, 0,313 ммоль). Потім одержану суміш струшували на орбітальному шейкері протягом 4,5 год. і потім концентрували у вакуумі до видалення всіх летких продуктів. Після цього висушений продукт очищали хроматографією на нормальній фазі (градієнт EtOAc/гексан), одержуючи 5-фтор-4-(2-фторбензиламіно)-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2H)-карбоксамід (75,3 мг, 68%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 154-157°C; ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 12,65 (с, 1H), 8,51 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,63-7,55 (м, 2H), 7,46 (тд, J=7,5, 1,7 Гц, 1H), 7,41-7,28 (м, 3H), 7,19-7,05 (м, 3H), 6,03 (с, 1H), 4,86 (д, J=5,9 Гц, 2H); ESI MC m/z 355 ([M-H]).

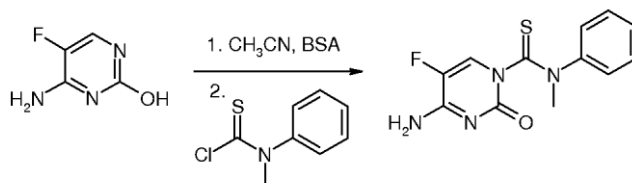
Сполуки 29-32 одержували за методикою прикладу 7.

40 Приклад 8: Одержання (Е)-4-((диметиламіно)метиленаміно)-N,N-діетил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2H)-карботіоаміду (33)



У 25-мл флакон із загвинчуваною кришкою вміщували (Е)-N'-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)-N,N-диметилформімідамід (99,7 мг, 0,541 ммоль), CH₃CN (5 мл) і BSA (0,0665 мл, 0,272 ммоль). Одержану суміш потім струшували на роторному шейкері при 80°C протягом 19 год. Після охолодження до кімнатної температури додавали тіофосген (0,0415 мл, 0,544 ммоль) і струшували реакційну суміш на роторному шейкері протягом 90 хв. Після закінчення цього часу додавали діетиламін (0,112 мл, 1,08 ммоль) і реакційну суміш струшували при кімнатній температурі протягом ще 1 год. Одержану гетерогенну суміш виливали у лійку з пористим фільтром і одержаний фільтрат концентрували у вакуумі. Після цього неочищену речовину очищали хроматографією на нормальній фазі (градієнт від 0 до 100% EtOAc/гексан), одержуючи (Е)-4-((диметиламіно)метиленаміно)-N,N-діетил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2Н)-карботіоамід (25,9 мг, 16%) у вигляді блідо-жовтої твердої речовини: т. пл. 118-123°C; ¹H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,60 (с, 1H), 8,41 (д, J=3,2 Гц, 1H), 3,20 (с, 3H), 3,34 (кв, J=6,7 Гц, 4H), 3,09 (с, 3H), 1,17 (с, 3H), 1,08 (с, 3H); ESI MS m/z 300 ([M+H]⁺).

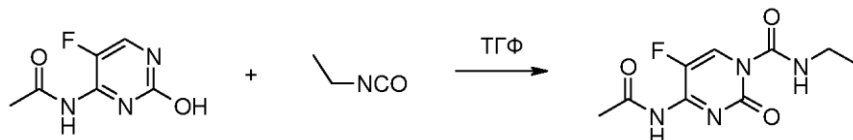
Приклад 9: Одержання 4-аміно-5-фтор-N-метил-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2Н)-карботіоаміду (34)



У 25-мл посудину із загвинчуваною кришкою вміщували 4-аміно-5-фторпіримідин-2-ол (100,1 мг, 0,775 ммоль), CH₃CN (3 мл) і BSA (0,284 мл, 1,162 ммоль). Після цього одержану суміш струшували на роторному шейкері при 65°C протягом 90 хв. Після охолодження до кімнатної температури додавали хлорангідрид метил(феніл)карбамотіонової кислоти (157,6 мг, 0,849 ммоль), і реакційну суміш струшували на роторному шейкері при 65°C протягом 16 год. Після охолодження до кімнатної температури, реакційну суміш розбавляли CH₂Cl₂ (100 мл) і промивали насиченим водним розчином NaCl (50 мл×2). Потім органічний шар висушували над Na₂SO₄, фільтрували і концентрували у вакуумі, одержуючи зелене масло. Після цього неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії на нормальній фазі (градієнт 0-35% MeOH/CH₂Cl₂), одержуючи 4-аміно-5-фтор-N-метил-2-оксо-N-фенілпіримідин-1(2Н)-карботіоамід (80,1 мг, 37%) у вигляді бежевої/зеленої твердої речовини з чистотою 90%: т. пл. 192-196°C; ¹H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,16 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,83 (с, 1H), 7,66 (с, 1H), 7,38 (м, 2H), 7,34-7,26 (м, 3H), 3,71 (с, 3H); ESI MS m/z 279 ([M+H]⁺).

Сполуки 35-37 одержували за методикою, аналогічною прикладу 9.

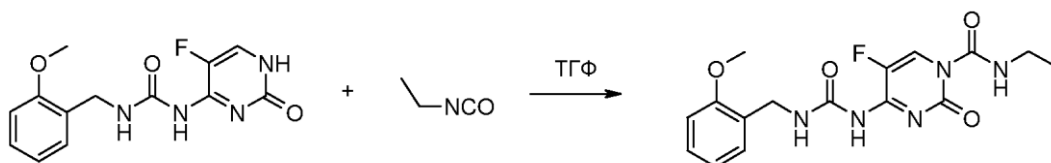
Приклад 10: Одержання 4-ацетамідо-N-етил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2Н)-карбоксаміду (38)



До суспензії N-(5-фтор-2-гідроксипіримідин-4-іл)ацетаміду (одержаного за методикою патенту США 3309359; 0,25 г, 1,46 ммоль) у сухому ТГФ (5 мл) додавали етилізоціанат (0,127 мл, 1,61 ммоль) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Розчинник видаляли у вакуумі і твердий залишок суспендували в Et₂O (10 мл). Суспензію фільтрували на вакуумній лійці і промивали Et₂O (2×10 мл). Одержану тверду речовину висушували у вакуумі, одержуючи 4-ацетамідо-N-етил-5-фтор-2-оксопіримідин-1(2Н)-карбоксамід (0,350 г, 99%) у вигляді твердої білої речовини: т. пл. 233-235°C; ¹H-ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,89 (с, 1H), 10,01 (с, 1H), 8,62 (д, J=7,0 Гц, 1H), 3,40-3,27 (м, 2H), 2,30 (с, 3H), 1,15 (т, J=7,2 Гц, 3H); ESI MS m/z 241 (M-H⁺).

Сполуки 39-48 одержували за методикою прикладу 10.

Приклад 11: Одержання N-етил-5-фтор-4-(3-(2-метоксибензил)уреїдо)-2-оксопіримідин-1(2Н)-карбоксаміду (49)

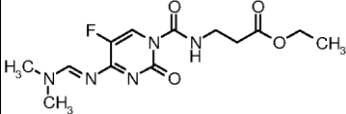
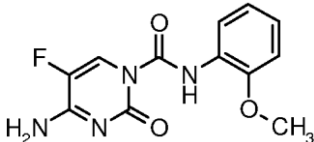
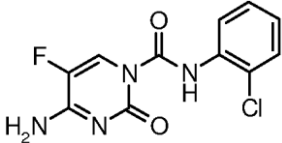
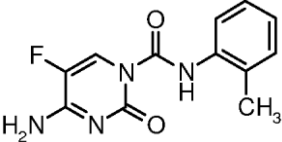
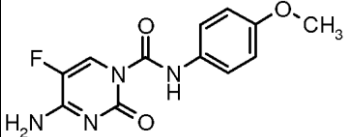


До суспензії 1-(5-фтор-2-оксо-1,2-дигідропіримідин-4-іл)-3-(2-метокси-бензил)сечовини (одержаної за методикою опублікованої заявки на патент США 2010/022538; 0,25 г, 0,855 ммоль) у сухому ТГФ (5 мл) додавали етилізоціанат (0,074 мл, 0,941 ммоль) і одержану суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 год. Розчинник видаляли у вакуумі і твердий залишок суспендували в Et₂O (10 мл). Суспензію фільтрували на вакуумній лійці і промивали Et₂O (2×10 мл). Виділену тверду речовину висушували у вакуумі, одержуючи N-етил-5-фтор-4-(3-(2-метоксибензил)уреїдо)-2-оксопіримідин-1(2H)-карбоксамід (0,150 г, 48%) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 248-250°C; ¹H-ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,56 (с, 1H), 9,92 (с, 1H), 9,68 (с, 1H), 8,55 (д, J=6,6 Гц, 1H), 7,33-7,20 (м, 2H), 7,02 (д, J=7,9 Гц, 1H), 6,91 (дд, J=7,9, 6,9 Гц, 1H), 4,41 (д, J=6,0 Гц, 2H), 3,88 (с, 3H), 3,38-3,24 (м, 2H), 1,14 (т, J=7,2 Гц, 3H); ESI MS m/z 362 ([M-H]⁻).

Сполуки 50-53 одержували за методикою прикладу 11.

Таблиця 1

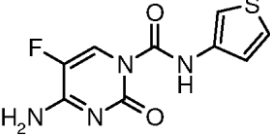
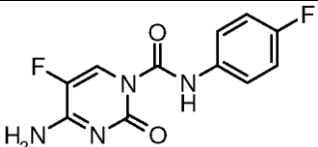
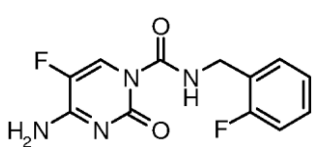
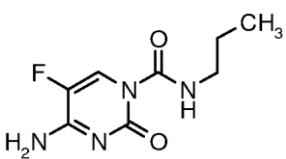
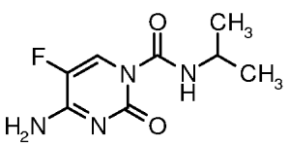
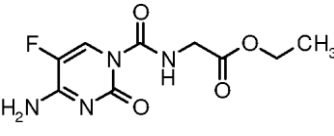
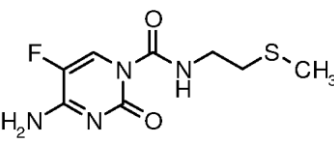
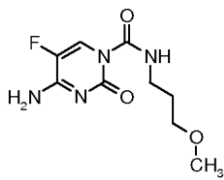
Сполуки і їх фізико-хімічні характеристики

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
2		біла тверда речовина	ESI MC m/z 328 ([M+H] ⁺)	232-236	10,42 (т, J=5,9 Гц, 1H), 8,77 (с, 1H), 8,36 (д, J=6,9 Гц, 1H), 4,06 (кв, J=7,1 Гц, 2H), 3,51(кв, J=6,3 Гц, 2H), 3,28 (с, 3H), 3,15 (с, 3H), 2,58 (кв, J=6,5 Гц, 2H), 1,17 (т, J=7,1 Гц, 3H)
7		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 276,94	277-280 з розкладанням	12,93 (с, 1H), 8,59 (с, 1H), 8,44 (д, J=7,58 Гц, 1H), 8,30 (с, 1H), 8,14-8,12 (м, 1H), 7,10-7,06 (м, 2H), 6,98-6,93 (м, 1H), 3,85 (с, 3H)
8		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 281,1	258-261	13,32 (с, 1H), 8,70 (с, 1H), 8,44 (д, J=7,25 Гц, 1H), 8,39 (с, 1H), 8,23 (дд, J=8,24, 1,65 Гц, 1H), 7,53 (дд, J=8,24, 1,32 Гц, 1H), 7,40-7,35 (м, 1H), 7,18-7,13 (м, 1H)
9		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 261,2	277-280 з розкладанням	12,76 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,45 (д, J=7,25 Гц, 1H), 8,35 (с, 1H), 7,96 (д, J=7,58 Гц, 1H), 7,26-7,17(м, 2H), 7,08-7,03 (м, 1H), 2,26 (с, 3H)
10		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 277,2	252-255	12,65 (с, 1H), 8,62 (с, 1H), 8,44 (д, J=7,42 Гц, 1H), 8,34 (с, 1H), 7,49-7,46 (м, 2H), 6,96-6,93 (м, 2H), 3,74 (с, 3H)

Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
11		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 298,86	251-254	12,91 (с, 1H), 8,70 (с, 1H), 8,50-8,34 (м, 2H), 7,91 (дд, J=6,7, 2,6 Гц, 1H), 7,57-7,48 (м, 1H), 7,44 (т, J=9,0 Гц, 1H)
12		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 282,8	261-264	12,90 (с, 1H), 8,68 (с, 1H), 8,44 (д, J=7,42 Гц, 1H), 8,39 (с, 1H), 7,62-7,59 (м, 2H), 7,45-7,42 (м, 2H)
13		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 272,1	254-257	13,20 (с, 1H), 8,74 (с, 1H), 8,47-8,43 (м, 2H), 7,86 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,77 (д, J=8,7 Гц, 2H)
15		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 260,99	257-260	12,73 (с, 1H), 8,62 (с, 1H), 8,43 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,34 (с, 1H), 7,43 (д, J=8,5 Гц, 2H), 7,17 (д, J=8,3 Гц, 2H), 2,27 (с, 3H)
16		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 277,2	242-244	12,83 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,43 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,36 (с, 1H), 7,29-7,20 (м, 2H), 7,09-7,04 (м, 1H), 6,74-6,68 (м, 1H), 3,75 (с, 3H)
17		блідо- жовта тверда речовина	ESI MC ⁻ 296,9	273-275	13,07 (с, 1H), 8,68 (с, 1H), 8,50 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,40 (с, 1H), 8,23 (д, J=2,0 Гц, 1H), 7,98-7,86 (м, 2H), 7,65-7,42 (м, 4H)
18		блідо- жовта тверда речовина	ESI MC ⁻ 299,99	268-270	12,72 (с, 1H), 8,60 (с, 1H), 8,48 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,33 (с, 1H), 7,84 (д, J=1,9 Гц, 1H), 7,44 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,35 (д, J=3,0 Гц, 1H), 7,23 (дд, J=8,7, 2,0 Гц, 1H), 6,42 (д, J=3,1 Гц, 1H), 3,79 (с, 3H)
19		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 303,2	282-284	12,96 (с, 1H), 8,66 (с, 1H), 8,49 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,38 (с, 1H), 8,21 (д, J=1,9 Гц, 1H), 8,00 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,81 (д, J=5,5 Гц, 1H), 7,52-7,45 (м, 2H)

Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
20		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 253,2	263-265	12,86 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,45 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,37 (с, 1H), 7,59-7,53 (м, 2H), 7,23 (дд, J=5,0, 1,6 Гц, 1H)
21		біла тверда речовина	ESI MC ⁻ 265,2	257-259	12,81 (с, 1H), 8,67 (с, 1H), 8,45 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,38 (с, 1H), 7,66-7,55 (м, 2H), 7,29-7,19 (м, 2H)
22		біла тверда речовина	ESI MC m/z 279 [M-H] ⁻	260-262	10,71 (т, J=5,6 Гц, 1H), 8,5 (с, 1H), 8,34 (д, J=7,2 Гц, 1H), 8,24 (с, 1H), 7,41-7,32 (м, 2H), 7,23-7,17 (м, 2H), 4,53 (д, J=5,6 Гц, 2H)
23		біла тверда речовина	ESI MC m/z 215 [M+H] ⁺	290-293	10,31 (т, J=5,7 Гц, 1H), 8,44 (с, 1H), 8,34 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,19 (с, 1H), 3,26-3,19 (м, 2H), 1,57-1,48 (м, 2H), 0,88 (т, J=7,0 Гц, 3H)
24		біла тверда речовина	ESI MC m/z 215 [M+H] ⁺	291-294	10,28 (д, J=7,2 Гц, 1H), 8,46 (с, 1H), 8,34 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,20 (с, 1H), 3,88 (дкв, J=13,3, 6,6 Гц, 1H), 1,18 (д, J=6,6 Гц, 6H)
25		біла тверда речовина	ESI MC m/z 257 [M-H] ⁻	220-224	10,53 (т, J=5,7 Гц, 1H), 8,50 (с, 1H), 8,33 (д, J=7,4 Гц, 1H), 8,27 (с, 1H), 4,17-4,05 (м, 4H), 1,20 (т, J=7,1 Гц, 3H)
26		блідо- рожева тверда речовина	ESI MC m/z 245 [M-H] ⁻	237-239	10,43 (т, J=5,6 Гц, 1H), 8,46 (с, 1H), 8,35 (д, J=7,5 Гц, 1H), 8,21 (с, 1H), 3,53-3,42 (м, 2H), 2,64 (т, J=6,7 Гц, 2H), 2,08 (с, 3H)
27		біла тверда речовина	ESI MC m/z 243 [M-H] ⁻	295-298	10,31 (т, J=5,5 Гц, 1H), 8,44 (с, 1H), 8,34 (д, J=7,5 Гц, 1H), 8,19 (с, 1H), 3,41-3,26 (м, 4H), 3,23 (с, 3H), 1,74 (пентет, J=6,5 Гц, 2H)

Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
29		біла тверда речовина	ESI MC m/z 391 ([M-H] ⁻)	150-153	(300 МГц, CDCl ₃) 12,86 (с, 1H), 8,46 (д, J=7,1 Гц, 1H), 8,18-8,03 (м, 1H), 7,47 (т, J=7,3 Гц, 1H), 7,34 (дд, J=13,9, 6,7 Гц, 1H), 7,23-7,05 (м, 2H), 6,99-6,84 (м, 2H), 6,11 (с, 1H), 4,86 (д, J=5,9 Гц, 2H)
30		біла тверда речовина	ESI MC m/z 369 ([M-H] ⁻)	158-162	(300 МГц, CDCl ₃) 12,55 (с, 1H), 8,51 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,46 (д, J=8,2 Гц, 3H), 7,34 (дд, J=13,4, 6,2 Гц, 1H), 7,21-7,05 (м, 4H), 6,05 (с, 1H), 4,86 (д, J=5,8 Гц, 2H), 2,34 (с, 3H)
31		біла тверда речовина	ESI MC m/z 389 ([M-H] ⁻)	158-160	(300 МГц, CDCl ₃) 12,78 (с, 1H), 8,47 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,73 (с, 1H), 7,51- 7,23 (м, 4H), 7,21- 7,06 (м, 3H), 6,11 (с, 1H), 4,86 (д, J=5,8 Гц, 2H)
32		біла тверда речовина	ESI MC m/z 321 ([M-H] ⁻)	113-116	(300 МГц, CDCl ₃) 10,31 (с, 1H), 8,42 (д, J=7,2 Гц, 1H), 7,43 (т, J=7,4 Гц, 1H), 7,32 (дд, J=14,0, 6,7 Гц, 1H), 7,18-7,02 (м, 2H), 6,02 (с, 1H), 4,82 (д, J=5,8 Гц, 2H), 3,34 (дд, J=13,0, 6,7 Гц, 2H), 1,72-1,56 (м, 2H), 0,97 (т, J=7,4 Гц, 3H)
35		жовта тверда речовина	ESI MC m/z 347 ([M+H] ⁺)	126-131	8,20 (д, J=6,8 Гц, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,81-7,56 (м, 5H), 3,76 (с, 3H)
36		блідो- жовта тверда речовина	ESI MC m/z 347 ([M+H] ⁺)	200-203	8,16 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,84 (с, 1H), 7,59 (с, 1H), 7,49 (д, J=1,9 Гц, 2H), 3,71 (с, 3H)

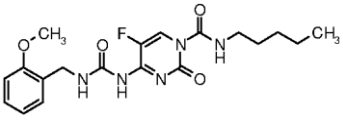
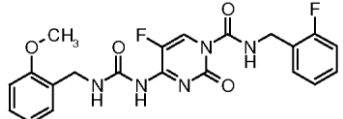
Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ Н-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
37		не зовсім біла тверда речовина	ESI MC m/z 293 ([M+H] ⁺)	223-226	8,15 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,81 (с, 1H), 7,63 (с, 1H), 7,42-7,35 (м, 2H), 7,35-7,23 (м, 3H), 4,37 (дкв, J=14,2, 7,1 Гц, 1H), 4,05 (дкв, J=14,2, 7,1 Гц, 1H), 1,20 (т, J=7,1 Гц, 3H)
39		біла тверда речовина	ESI MC m/z 255 ([M-H] ⁻)	233-235	(300 МГц, CDCl ₃) 10,13 (с, 1H), 8,65 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,38 (с, 1H), 3,39 (тд, J=7,0, 5,8 Гц, 2H), 2,68 (с, 3H), 1,75-1,52 (м, 2H), 0,99 (т, J=7,4 Гц, 3H)
40		біла тверда речовина	ESI MC m/z 317 ([M-H] ⁻)	258-260	11,98 (с, 1H), 9,49 (с, 1H), 8,48 (с, 1H), 8,01-7,88 (м, 2H), 7,59 (м, 3H), 3,33-3,21 (м, 2H), 1,75-1,33 (м, 2H), 0,90 (т, J=7,4 Гц, 3H)
41		біла тверда речовина	ESI MC m/z 283 ([M-H] ⁻)	226-228	10,82 (с, 1H), 10,05 (с, 1H), 8,6 (д, J=5,1 Гц, 1H), 3,28-3,21 (м, 2H), 3,0-2,85 (м, 1H), 1,58-1,46 (м, 2H), 1,07 (д, J=6,86 Гц, 6H), 0,89 (т, J=7,14 Гц, 3H)
42		біла тверда речовина	ESI MC m/z 351 ([M-H] ⁻)	239-241	11,74 (с, 1H), 9,95 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 7,69-7,42 (м, 4H), 3,34-3,21 (м, 2H), 1,63-1,45 (м, 2H), 0,89 (т, J=7,14 Гц, 3H)
43		ясно-жовта тверда речовина	ESI MC m/z 361 ([M-H] ⁻)	227-229	11,06 (с, 1H), 10,05 (с, 1H), 8,63 (д, J=7,3 Гц, 1H), 7,28-7,17 (м, 2H), 6,95-6,84 (м, 2H), 3,87 (с, 2H), 3,73 (с, 3H), 3,33-3,13 (м, 2H), 1,64-1,45 (м, 2H), 0,89 (т, J=7,14 Гц, 3H)
44		біла тверда речовина	ESI MC m/z 303 ([M-H] ⁻)	249-251	11,97 (с, 1H), 9,21 (с, 1H), 8,55-8,25 (м, 1H), 8,04-7,89 (м, 2H), 7,71-7,46 (м, 3H), 3,36-3,28 (м, 2H), 1,14 (т, J=7,2 Гц, 3H)

Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
45		біла тверда речовина	ESI MC m/z 269 ([M-H] ⁺)	226-228	10,88 (с, 1H), 10,02 (с, 1H), 8,61 (д, J=7,0 Гц, 1H), 3,37-3,28 (м, 2H), 3,05-2,87 (м, 1H), 1,27-1,03 (м, 9H)
46		блідо- коричнева тверда речовина	ESI MC m/z 337 ([M-H] ⁺)	239-241	11,74 (с, 1H), 9,84 (с, 1H), 8,64 (с, 1H), 7,58-7,40 (м, 4H), 3,43-3,18 (м, 2H), 1,18-1,10 (т, J=7,42 Гц, 3H)
47		біла тверда речовина	ESI MC m/z 337 ([M-H] ⁺)	170-172	10,91 (с, 1H), 10,44 (с, 1H), 8,61 (д, J=7,0 Гц, 1H), 7,56-7,25 (м, 4H), 4,52 (д, J=6,0 Гц, 2H), 2,31 (с, 3H)
48		біла тверда речовина	ESI MC m/z 399 ([M-H] ⁺)	210-212	(300 МГц, CDCl ₃) 12,99 (с, 1H), 9,58 (с, 1H), 8,55 (д, J=6,6 Гц, 1H), 8,31 (д, J=6,6 Гц, 2H), 7,67-7,57 (м, 1H), 7,54-7,45 (м, 2H), 7,39-7,24 (м, 4H), 4,57 (д, J=5,8 Гц, 2H)
50		біла тверда речовина	ESI MC m/z 376 ([M-H] ⁺)	251-253	10,58 (с, 1H), 9,91 (д, J=7,3 Гц, 1H), 9,66 (с, 1H), 8,55 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,35-7,19 (м, 2H), 7,02 (д, J=8,1 Гц, 1H), 6,92 (т, J=7,3 Гц, 1H), 4,41 (д, J=5,3 Гц, 2H), 3,97-3,85 (м, 4H), 1,20 (д, J=6,6 Гц, 6H)
51		біла тверда речовина	ESI MC m/z 376 ([M-H] ⁺)	248-250	10,57 (с, 1H), 9,98 (с, 1H), 9,68 (с, 1H), 8,55 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,33-7,21 (м, 2H), 7,02 (д, J=7,9 Гц, 1H), 6,91 (td, J=7,4, 0,9 Гц, 1H), 4,41 (д, J=5,9 Гц, 2H), 3,88 (с, 3H), 3,32-3,20 (м, 2H), 1,62-1,45 (м, 2H), 0,89 (т, J=7,4 Гц, 3H)

Продовження таблиці 1

№ сполуки	Структура	Зовнішній вигляд	МС	т. пл.(°C)	¹ H-ЯМР (δ, ДМСО-d ₆)
52		біла тверда речовина	ESI MC m/z 404 ([M-H] ⁺)	248-250	10,57 (с, 1H), 9,97 (с, 1H), 9,67 (с, 1H), 8,55 (д, J=6,4 Гц, 1H), 7,33-7,21 (м, 2H), 7,02 (д, J=8,2 Гц, 1H), 6,91 (тд, J=7,5, 0,9 Гц, 1H), 4,41 (д, J=5,6 Гц, 2H), 3,87 (с, 3H), 3,35-3,22 (м, 2H), 1,59-1,45 (м, 2H), 1,36-1,21 (м, 4H), 0,87 (т, J=6,9 Гц, 3H)
53		біла тверда речовина	ESI MC m/z 442 ([M-H] ⁺)	229-231	10,59 (с, 1H), 10,38 (с, 1H), 9,67 (с, 1H), 8,55 (д, J=7,0 Гц, 1H), 7,48-7,13 (м, 6H), 7,02 (д, J=7,9 Гц, 1H), 6,91 (тд, J=7,4, 0,9 Гц, 1H), 4,57 (д, J=5,9 Гц, 2H), 4,41 (д, J=5,4 Гц, 2H), 3,87 (с, 3H)

¹Всі спектральні дані зареєстровані у ДМСО-d₆ при 300 або 400 МГц, якщо не вказано інше.

Приклад 7: Оцінка фунгіцидної активності: септоріозна плямистість листя пшениці (*Mycosphaerella graminicola*; анаморф: *Septoria tritici*; код Bayer SEPTTR)

- 5 Рослини пшениці (сорт: Yuma) вирощували з насіння у теплиці у суміші 50 % мінерального ґрунту/50 % безґрунтової суміші Metro до повної появи першого листа, у кількості 7-10 сіянців на горщик. Ці рослини заражали водною суспензією спор *Septoria tritici* або до, або після обробки фунгіцидом. Після зараження рослини витримували при відносній вологості 100 % (один день у темній зрошуваній камері і потім два-три дні у світлій зрошуваній камері), щоб дати можливість
- 10 спорам прорости та інфікувати листя. Після цього рослини переміщали у теплицю, щоб дати захворюванню розвинутися.

- У показаній нижче таблиці представлена активність типових сполук за даним винаходом, оцінка якої проводилася в описаному вище експерименті. Ефективність сполук, що тестуються, у боротьбі із захворюванням визначали шляхом оцінки тяжкості захворювання на оброблених
- 15 рослинах, з подальшим представленням тяжкості у процентах від контролю, виходячи з тяжкості захворювання на заражених рослинах, які не оброблені сполуками, що тестуються.

У всіх випадках у таблиці 2 застосовувалася наведена нижче шкала оцінки:

% захворювання від контролю	Оцінка
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
Не тестувалося	E

Таблиця 2

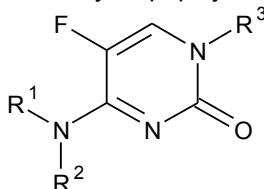
Одноденна захисна (1DP) і триденна лікувальна (3DC) активність сполук відносно SEPTTR при концентрації 100 ч./млн.

№ сполуки	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	A	C
12	A	A
13	A	B
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A
21	A	A
22	A	A
23	A	A
24	A	A
25	A	A
26	A	A
27	A	A
28	D	C
29	D	C
30	D	C
31	D	D
32	C	B
33	D	C
34	A	A
35	A	A
36	A	A
37	A	A
38	A	A
39	A	A
40	A	A
41	A	A
42	C	A
43	A	A
44	A	A
45	A	A
46	A	B
47	A	A
48	A	A
49	D	D
50	D	D
51	D	D

№ сполуки	SEPTTR 100 ч./млн. 1DP	SEPTTR 100 ч./млн. 3DC
52	D	D
53	D	D

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука формули (I):



де R¹ являє собою:

H;

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

10 C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁴;

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

феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу необов'язково може бути заміщений 1-3 фрагментами R⁵ або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою,

або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6,

15 кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

-C(=S)R⁸;

20 -C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; або

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

25 де m означає ціле число від 1 до 3;

R² являє собою H або C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений R⁴;

як альтернатива, R¹ і R² можуть спільно утворювати фрагмент CR¹¹N(R¹²)R¹³;

R³ означає -C(=O)N(R⁹)R¹⁰ або -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

30 R⁴ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₄алкілтіо, C₁-C₄галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C₁-C₃алкіламіно, C₂-C₆алкоксикарбоніл, C₂-C₆алкілкарбоніл, C₂-C₆алкіламінокарбоніл, гідроксил або C₃-C₆тріалкілсиліл;

R⁵ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-C₆галогеналкілтіо, галогентіо, аміно, C₁-C₆алкіламіно, C₂-C₆діалкіламіно, C₂-C₆алкоксикарбоніл або C₂-C₆алкілкарбоніл, нітро, гідроксил або ціано;

35 R⁶ означає H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, бензил або феніл, де кожний із вказаних бензилу і фенілу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵;

R⁷ означає H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₃-C₆алкініл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксіалкіл, C₂-C₆алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути

40 необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵ або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

45 R⁸ означає H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₃-C₆алкініл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵ або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3

фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

50 R⁹ означає H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₃-C₆алкініл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксіалкіл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R⁵ або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3

фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

фрагментами R⁵, біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеними 1-3 фрагментами R⁵;

- R^9 означає Н, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_1 - C_6 алкілалкоксикарбоніл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, $-(CH_2)_mSCH_3$, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або
- 5 конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 фрагментами R^5 ;
- R^{10} означає Н, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксіалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, бензил, де бензил може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ;
- 10 як альтернатива, R^9 і R^{10} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ;
- R^{11} означає Н або C_1 - C_4 алкіл;
- R^{12} означає Н, ціано, гідроксил, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил,
- 15 де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 або 5- або 6-членною насиченою або ненасиченою циклічною системою, або конденсованою циклічною системою 5-6, або конденсованою циклічною системою 6-6, кожна з яких містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 , біфенілом або нафтилом, необов'язково заміщеним 1-3 фрагментами R^5 ;
- 20 як альтернатива, R^{11} і R^{12} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ;
- R^{13} означає Н, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкілкарбоніл, феніл або бензил, де кожний із вказаних фенілу і бензилу може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 ; і
- 25 як альтернатива, R^{12} і R^{13} можуть спільно утворювати 5- або 6-членний насичений або ненасичений цикл, що містить 1-3 гетероатоми, де кожний цикл може бути необов'язково заміщений 1-3 фрагментами R^5 .
2. Композиція для боротьби з грибовими патогенами, що містить сполуку за п. 1 і фітологічно прийнятний носій.
- 30 3. Композиція за п. 2, де грибовий патоген являє собою паршу яблуні (збудник *Venturia inaequalis*), септоріозну плямистість листя пшениці (збудник *Septoria tritici*), церкоспорозну плямистість листя цукрового буряка (збудник *Cercospora beticola*), плямистість листя арахісу (збудник *Cercospora arachidicola* і *Cercosporidium personatum*) і чорну сигатокку бананів (збудник *Mycosphaerella fijiensis*).
- 35 4. Спосіб боротьби з грибовим ураженням рослин і запобігання цьому ураженню, де вказаний спосіб включає стадії:
- нанесення фунгіцидно-ефективної кількості щонайменше однієї зі сполук за п. 1 щонайменше на одну рослину, область, прилеглу до рослини, ґрунт, призначений для підтримування росту рослини, коріння рослини, листя рослини або насіння, призначене для одержання рослин.
- 40