



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 107865

(13) C2

(51) МПК

C07D 231/16 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2013 06280	(72) Винахідник(и):	Бентінг Юрген (DE), Крісто П'єр (FR), Деборде Філіп (FR), Гарі Стефан (FR), Грел Йорг (DE), Хелмке Хендрік (DE)
(22) Дата подання заявки:	20.10.2011	(73) Власник(и):	БАЙЄР ІНТЕЛЕКТУАЛ ПРОПЕРТІ ГМБХ, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, Germany (DE)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	25.02.2015	(74) Представник:	Льгова Майя Миколаївна, реєстр. №12
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	10356028.0, 61/421,033	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2009016221 A1, 05.02.2009 WO 2009024342 A2, 26.02.2009 WO 2009153191 A1, 23.12.2009 WO 2010130767 A2, 18.11.2010
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	21.10.2010, 08.12.2010		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	EP, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.07.2013, Бюл.№ 13		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	25.02.2015, Бюл.№ 4		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2011/068288, 20.10.2011		

(54) ГЕТЕРОЦИКЛІЧНІ КАРБОКСАМІДИ

(57) Реферат:

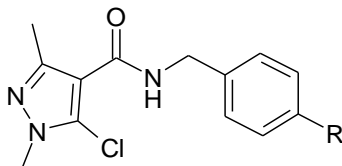
Цей винахід стосується похідних N-бензил гетероциклічних карбоксамідів та їхніх тіокарбоксамідних похідних, способу їх одержання, їх застосування як фунгіцидів, зокрема у вигляді композицій, та способів боротьби з фітопатогенними грибами, особливо рослин, із застосуванням цих сполук або композицій.

UA 107865 C2

Цей винахід стосується похідних N-бензил гетероциклічних карбоксамідів або їх тіокарбоксамідних похідних, способу їх одержання, їх застосування як фунгіцидів, зокрема у вигляді композицій, та способів боротьби з фітопатогенними грибами, особливо рослин, із застосуванням цих сполук або їх композицій.

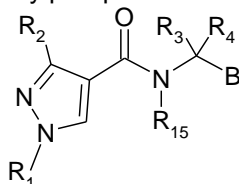
У публікації Art antérieur: Le PRO10-007 n'est pas un brevet de sélection à proprement parler car la publication ne revendique pas de CHF2 en 3-du pyrazole

J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91 [CAN 117:207009] загалом охоплені деякі фунгіцидні амідні у такій формулі:



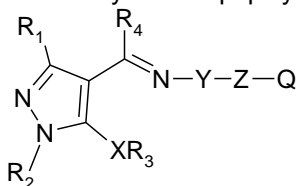
де R може означати атом водню, атом хлору, метильну групу або метокси групу. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої такої похідної, де 3-замісник піразолільної групи може означати дигалогенметильну групу. Крім того, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, що містить алкільну групу, алкокси групу або C₄-C₇-циклоалкільну групу, сполучену з атомом азоту карбоксамідного залишку.

В міжнародній патентній заявці WO-2009/024342 загалом охоплені деякі фунгіцидні амідні піразол-4-карбонової кислоти у широкому розкритті численних сполук такої формулі:



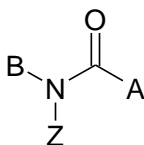
де R₁ може означати алкільну групу, R₂ може означати галогеналкільну групу, R₁₅ може означати атом водню або циклопропільну групу, R₃ або R₄ можуть означати різні замісники, з-поміж яких алкільна група, галоалкільна група та подібне, а B може означати фенільну групу, нафтильну групу або моно- чи біциклічну гетероароматичну кільцеву систему. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої такої похідної, в якій 5-замісник піразолільної групи може означати атом галогену. Крім того, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, що містить алкільну групу, алкокси групу або C₄-C₇-циклоалкільну групу, сполучену з атомом азоту карбоксамідного залишку.

У міжнародній патентній заявці CN1188764 загалом охоплені деякі фунгіцидні піразольні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формулі:



де R₁ або R₂ можуть означати алкільну групу або галогеналкільну групу, X може означати прямий зв'язок, R₃ може означати різні замісники, з-поміж яких атом хлору, R₄ може означати різні замісники, з-поміж яких атом кисню або сірки, Y і Z можуть означати прямий зв'язок, а Q може означати різні групи, з-поміж яких заміщена бензильна група. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, що містить алкільну групу, алкокси групу або C₄-C₇-циклоалкільну групу, сполучену з атомом азоту карбоксамідного залишку. Крім того, цей документ чітко не розкриває і не пропонує вибирати будь-яку таку похідну, в якій піразолільна група може означати 1-метил-3-(дифтор або дихлор)метил-5-(хлор або фтор)-4-піразолільну групу.

У міжнародних патентних заявках WO-2006/120224 та WO-2007/087906 загалом охоплені деякі амідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формулі:

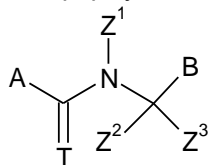


де A може означати карбо-сполучену, частково насичену або ненасичену, 5-членну

гетероциклічну групу, яка може бути заміщена, Z може означати (не)заміщену циклоалкілну групу, а B може означати (не)заміщену бензильну групу або заміщену 2-піридилметилєнову групу. Однак, ці документи не розкривають і не пропонують будь-якої сполуки, що містить атом водню, алкілєну групу або алкокси групу, сполучєну з атомом азоту карбоксамідного залишку.

5 Крім того, ці документи чітко не розкривають і не пропонують вибирати будь-яку таку похідну, в якій A може означати 1-метил-3-(дифтор або дихлор)метил-5-(хлор або фтор)-4-піразолілєну групу.

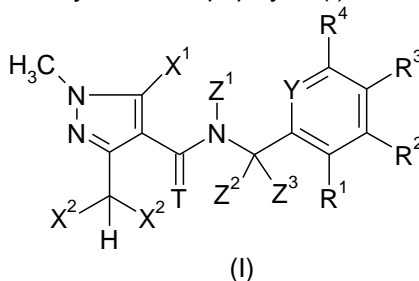
У міжнародній патентній заявці WO-2009/016221 загалом охоплені деякі амідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



де A може означати карбо-сполучєну, частково насичєну або ненасичєну, 5-членну гетероциклічну групу, яка може бути заміщена, T може означати O або S, Z¹ може означати (не)заміщену циклоалкілєну групу, Z² і Z³ можуть означати атом водню, C₁-C₈-алкіл з-поміж інших груп, а B може означати нафтильну групу або біциклічну гетероароматичну групу. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, що містить атом водню, алкілєну групу або алкокси групу, сполучєну з атомом азоту карбоксамідного залишку. Крім того, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, в якій B має бути заміщено фєнілєною групою або 2-піридилєною групою. Крім того, ці документи чітко не розкривають і не пропонують вибирати будь-яку таку похідну, в якій A може означати 1-метил-3-(дифтор або дихлор)метил-5-(хлор або фтор)-4-піразолілєну групу.

У галузі сільського господарства завжди великий інтерес становить використання нових пестицидних сполук для уникнення або регулювання розвитку стійких штамів до активних інгредієнтів. Також великий інтерес становить застосування нових сполук, які є більш активними, ніж вже відомі сполуки, з метою зниження кількості активної сполуки, що підлягає використанню, при одночасному збереженні ефективності, щонайменше еквівалентної до ефективності вже відомих сполук. Ми тепер знайшли нове сімейство сполук, які мають згадані вище ефекти або переваги.

Відповідно, цей винахід забезпечує похідні формули (I)



(I)

де

- Y означає CR₅ або N;
- T означає O або S;
- X₁ та X₂, які можуть бути однаковими або різними, означають атом хлору або фтору;
- Z₁ означає атом водню, заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкеніл; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкініл; заміщений або незаміщений C₄-C₇-циклоалкіл; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений 3-оксетаніл; або заміщений чи незаміщений 3-тіетаніл;
- Z₂ і Z₃, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкеніл; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкініл; ціано; ізонітрил; нітро; атом галогєну; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкенілокси; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкінілокси; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфоніл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфініл; аміно; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений ді-C₁-C₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбоніл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбамоїл; заміщений або

незаміщений ді-С1-С8-алкілкарбамоїл; або заміщений або незаміщений N-С1-С8-алкіл-С1-С8-алкокси-карбамоїл; або

- Z3 і R1 разом з послідовними атомами вуглецю, що яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5-, 6- або 7-членний, частково насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3 гетероатомів, а Z2 має описане тут значення; або

- Z2 і Z3 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений С3-С7 циклоалкіл;

- R1, R2, R3, R4 і R5, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; нітро; ціано; ізонітрil; гідроксил; сульфаніл; аміно; пентафтор-λ6-сульфаніл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкіл; С1-С8-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкіламіно; заміщений або незаміщений ді-С1-С8-алкіламіно; заміщений або незаміщений С1-С8-алкокси; С1-С8-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; С1-С8-алкокси-С1-С8-алкіл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілсульфаніл; С1-С8-галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С2-С8-алкеніл; С2-С8-галогеналкеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С2-С8-алкініл; С2-С8-галогеналкініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С2-С8-алкенілокси; С2-С8-галогеналкенілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С2-С8-алкінілокси; С2-С8-галогеналкінілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С3-С7-циклоалкіл; С3-С7-галогенциклоалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С3-С7-циклоалкіл-С1-С8-алкіл; заміщений або незаміщений С3-С7-циклоалкіл-С2-С8-алкеніл; заміщений або незаміщений С3-С7-циклоалкіл-С2-С8-алкініл; заміщений або незаміщений С3-С7-циклоалкіл-С3-С7-циклоалкіл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкіл-С3-С7-циклоалкіл; форміл; формілокси; форміламіно; карбокси; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; (гідроксііміно)-С1-С8-алкіл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілкарбоніл; С1-С8-галогеналкілкарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ді-С1-С8-алкілкарбамоїл; N-(заміщений або незаміщений С1-С8-алкілокси) карбамоїл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкоксикарбамоїл; N-(заміщений або незаміщений С1-С8-алкіл)-(заміщений або незаміщений С1-С8-алкокси)-карбамоїл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкоксикарбоніл; С1-С8-галогеналкоксикарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкіламінокарбоніл; ди-заміщений або незаміщений С1-С8-алкіламінокарбоніл; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілкарбонілокси; С1-С8-галогеналкілкарбонілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілкарбоніламіно; С1-С8-галогеналкілкарбоніламіно, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкіламінокарбонілокси; заміщений або незаміщений ді-С1-С8-алкіламінокарбонілокси; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілоксикарбонілокси; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілсульфініл; С1-С8-галогеналкілсульфініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкілсульфоніл; С1-С8-галогеналкілсульфоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С1-С8-алкоксііміно; (С1-С8-алкоксііміно)-С1-С8-алкіл; заміщений або незаміщений (С1-С8-алкенілоксііміно)-С1-С8-алкіл; (С1-С8-алкінілоксііміно)-С1-С8-алкіл; (бензилоксііміно)-С1-С8-алкіл; три(заміщений або незаміщений С1-С8-алкіл)силіл; три(заміщений або незаміщений С1-С8-алкіл)силіл-С1-С8-алкіл; бензилокси, який може бути заміщений до 5 групами Q; бензилсульфаніл, який може бути заміщений до 5 групами Q; бензиламіно, який може бути заміщений до 5 групами Q; арил, який може бути заміщений до 7 групами Q; арилокси, який може бути заміщений до 7 групами Q; ариламін, який може бути заміщений до 7 групами Q; арилсульфаніл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С1-С8-алкіл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С2-С8-алкеніл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С2-С8-алкініл, який може бути заміщений до 7 групами Q; піридиніл, який може бути заміщений до 4 групами Q; піридинілокси, який може бути заміщений до 4 групами Q; арил-С3-С7-циклоалкіл, який може бути заміщений до 7 групами Q; або

- два сусідні замісники R разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5- або 6-членний, насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3 гетероатомів, а інші замісники R мають описані тут значення; або

- R1 і Z3 разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5-, 6- або 7-членний, частково насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3-х гетероатомів, а R2-R5 мають описані тут значення;

- Q, який може бути однаковим або різним, означає атом галогену; ціано; нітро; C1-C8-алкіл; C1-C8-алкокси; C1-C8-алкілсульфаніл; C1-C8-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C1-C8-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; трі(C1-C8)алкілсиліл або трі(C1-C8)алкілсиліл-C1-C8-алкіл;

а також її солі, N-оксиди, металеві комплекси, металоїдні комплекси та оптично-активні або геометричні ізомери.

Якщо не вказано інакше, група або замісник, заміщені відповідно до винаходу, можуть бути заміщені однією або більше з таких груп або атомів: атом галогену; нітро; гідроксил; ціано; ізонітрil; аміно; тіо; пентафтор-λ⁶-сульфанільна група; форміл; формілокси; форміламіно; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; (гідроксііміно)-C₁-C₆-алкіл; C₁-C₈-алкіл; трі(C₁-C₈-алкіл)силіл; C₃-C₈-циклоалкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₃-C₈-галогенциклоалкіл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-алкінілокси; C₁-C₈-алкіламіно; ді-C₁-C₈-алкіламіно; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеналкенілокси, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₃-C₈-алкінілокси; C₃-C₈-галогеналкінілокси, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбамоїл; ді-C₁-C₈-алкілкарбамоїл; N-C₁-C₈-алкілоксикарбамоїл; C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; N-C₁-C₈-алкіл-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-галогеналкоксикарбоніл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбонілокси; C₁-C₈-галогеналкілкарбонілокси, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбоніламін; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніламіно, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси; ді-C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси; C₁-C₈-алкілоксикарбонілокси; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 4 атомів галогену; C₁-C₈-алкіламіносульфамойл; ді-C₁-C₈-алкіламіносульфамойл; (C₁-C₆-алкоксііміно)-C₁-C₆-алкіл; (C₁-C₆-алкенілоксііміно)-C₁-C₆-алкіл; (C₁-C₆-алкінілоксііміно)-C₁-C₆-алкіл; 2-оксопіролідин-1-іл; (бензілоксііміно)-C₁-C₆-алкіл; C₁-C₈-алкоксіалкіл; C₁-C₈-галогеналкоксіалкіл, що має від 1 до 4 атомів галогену; бензілокси; бензілсульфаніл; бензиламіно; арилокси; арилсульфаніл або ариламін.

Будь-які зі сполук за винаходом можуть існувати у вигляді одного або більше стереоізомерів залежно від кількості стереогенних одиниць (як визначено правилами IUPAC – Міжнародного союзу фундаментальної та прикладної хімії) у сполучі. Відповідно, винахід однаково стосується всіх стереоізомерів та сумішей всіх можливих стереоізомерів в усіх пропорціях. Стереоізомери можуть бути відокремлені за допомогою методів, що є відомими як такі спеціалістові у цій галузі.

Для сполук за винаходом наведені далі родові поняття звичайно використовують з такими значеннями:

- галоген означає фтор, хлор, бром або йод;
- гетероатомом може бути азот, кисень або сірка;
- будь-яка алкільна, алкенільна або алкінільна група може бути лінійною або розгалуженою;
- термін "арил" означає феніл або нафтил, необов'язково заміщений;
- у разі аміногрупи або аміночастки будь-якої іншої амін-вмісної групи, заміщеної двома замісниками, які можуть бути однаковими або різними, два замісники разом з атомом азоту, до якого вони прикріплені, можуть утворювати гетероциклічну групу, краще гетероциклічну групу з 5-7 членами, яка може бути заміщена або може містити інші гетероатоми, наприклад, морфоліногрупу або піперидинільну групу.

Сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Y означає CR⁵.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Y означає N.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких T означає O.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких X¹ означає атом фтору.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких X^2 означає атом фтору.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z^1 означає атом водню.

5 Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z^1 означає метил або етил.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z^1 означає незаміщений циклобутил.

10 Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z^2 і Z^3 незалежно означають атом водню або метил.

Сполуками формули (I) за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки, в яких Z^2 означає атом водню і Z^3 означає атом водню або метил.

15 Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і R^5 , які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; $\text{трі}(C_1$ - C_8 -алкіл)силіл; або заміщений чи незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфаніл.

20 Сполуками формули (I) за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки, в яких замісник R^1 означає атом галогену; C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що містять до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C_3 - C_7 -циклоалкіл; $\text{трі}(C_1$ - C_8 -алкіл)силіл або C_1 - C_8 -галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

25 Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки, в яких замісники R^1 і R^5 , які можуть бути однаковими або різними, означають атом галогену; C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C_3 - C_7 -циклоалкіл; $\text{трі}(C_1$ - C_8 -алкіл)силіл або C_1 - C_8 -галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

30 Наведені вище переваги стосовно замісників сполук формули (I) за винаходом можуть бути поєднані різноманітними способами окремо, частково або повністю. Таким чином ці комбінації ознак, яким надають перевагу, забезпечують підкласи сполук за винаходом. Прикладами таких підкласів кращих сполук за винаходом, які можуть бути поєднані, є:

- кращі ознаки T з кращими ознаками одного або більше з X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки X_1 з кращими ознаками одного або більше з T, X_2 , Y, Z_1 - Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки X_2 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , Y, Z_1 - Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- 35 - кращі ознаки Y з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Z_1 - Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки Z_1 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_2 , Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки Z_2 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 , Z_3 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки Z_3 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 , Z_2 та/або R_1 - R_5 ;
- кращі ознаки R_1 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 та/або R_2 - R_5 ;
- 40 - кращі ознаки R_2 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 , R_1 та/або R_3 - R_5 ;

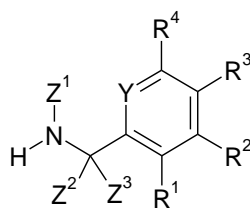
- кращі ознаки R_3 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 , R_1 , R_2 , R_4 та/або R_5 ;

45 - кращі ознаки R_4 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 , R_1 - R_3 та/або R_5 ;

- кращі ознаки R_5 з кращими ознаками одного або більше з T, X_1 , X_2 , Y, Z_1 - Z_3 та/або R_1 - R_4 ;

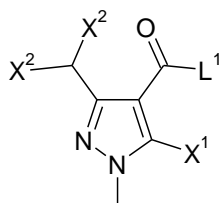
У цих комбінаціях кращих ознак замісників сполук за винаходом згадані кращі ознаки можуть також бути вибрані із ще кращих ознак кожного з T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 - Z^3 та R^1 - R^5 для утворення найкращих підкласів сполук за винаходом.

50 Цей винахід також стосується способу одержання сполуки формули (I). Отже, відповідно до іншого аспекту цього винаходу забезпечений спосіб P1 одержання сполуки формули (I), як визначено у цьому описі, в якій T означає O і який включає введення у реакцію похідної N-заміщеного аміну формули (II) або однієї з її солей:



(II)

де Z^1 , Z^2 , Z^3 , Y , R^1 , R^2 , R^3 та R^4 мають визначені тут значення; з похідною карбонової кислоти формули (III):



(III)

де X^1 та X^2 мають визначені тут значення, а L^1 означає відхідну групу, вибрану з переліку, що складається з атому галогену, гідроксильної групи, $-OR^a$, $-OC(=O)R^a$, де R^a означає заміщений або незаміщений C_1 - C_6 -алкіл, заміщений або незаміщений C_1 - C_6 -галоалкіл, бензил, 4-метоксибензил або пентафторфенільну групу; у присутності каталізатора та у присутності конденсувального агента, якщо L^1 означає гідроксильну групу, та у присутності кислотної зв'язуючої речовини, якщо L^1 означає атом галогену.

N-заміщені похідні аміну формули (II) є відомими або їх можна одержати за допомогою відомих способів, таких як відновлювальне амінування альдегідів або кетонів (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters («

Джерела інформації: з біоорганіки та медичної хімії") (2006), 16, 2014), або відновлюванням імінів (Tetrahedron ("Тетраедр") (2005), 61, 11689), або нуклеофільним заміщенням галогену, мезилату чи тозилату (Journal of Medicinal Chemistry ("Журнал з медичної хімії") (2002), 45, 3887).

Похідні карбонової кислоти формули (III) можуть бути одержані способом P2.

У разі, якщо L^1 означає гідроксигрупу, спосіб за цим винаходом проводять у присутності конденсувального агента. Підходящий конденсувальний агент може бути вибраний з необмеженого переліку, що складається з утворювача галоїдної кислоти, такого як фосген, трибромід фосфору, трихлорид фосфору, пентахлорид фосфору, оксид трихлориду фосфору або хлорид тіонілу; утворювача ангідриду, такого як етил хлорформат, метил хлорформат, ізопропіл хлорформат, ізобутил хлорформат або метансульфоніл хлорид; карбодіімідів, таких як N, N'-дициклогексилкарбодіімід (DCC), або інших традиційних конденсувальних агентів, таких як пентоксид фосфору, поліфосфорна кислота, N, N'-карбоніл-діімідазол, 2-етокси-N-етоксикарбоніл-1,2-дигідрохінолін (EEDQ), трифенілфосфін/тетрахлор-метан, гідрат 4-(4,6-диметокси[1.3.5]-тріазин-2-іл)-4-метилморфолінхлориду, бром-трипіролідінфосфонію гексафторфосфат або пропанфосфонієвий ангідрид (ТЗР).

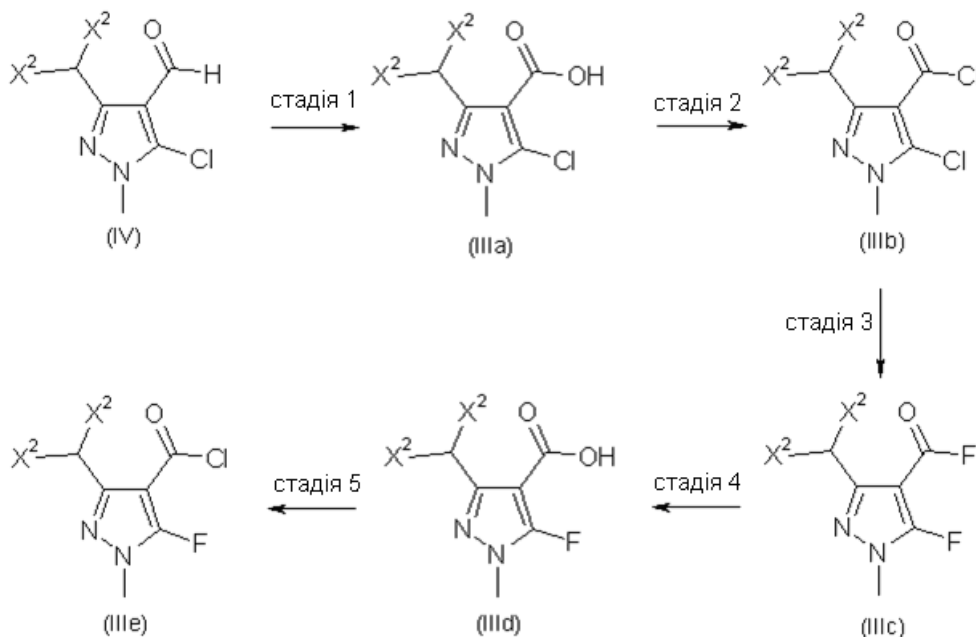
Спосіб за цим винаходом проводять у присутності каталізатора. Підходящий каталізатор може бути вибраний з переліку, що складається з 4-диметил-амінопіридину, 1-гідрокси-бензотріазолу або диметилформаміду.

У разі, якщо L^1 означає атом галогену, спосіб за цим винаходом проводять у присутності кислотної зв'язуючої. Підходящі кислотні зв'язуючі для здійснення способу P1 за винаходом у кожному разі всі є неорганічними та органічними основами, що є звичними для таких реакцій. Перевагу надають застосуванню лужноземельних металів, гідридів лужних металів, гідроксидів лужних металів або алькоксидів лужних металів, таких як гідроксид натрію, гідрид натрію, гідроксид кальцію, гідроксид калію, терт-бутоксид калію або інший гідроксид амонію, лужноземельних карбонатів, таких як карбонат цезію, карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію, ацетатів лужних металів або лужноземельних металів, таких як ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, а також третинних амінів, таких як триметиламін, тріетиламін, діізопропілетиламін, трибутиламін, N, N-диметиламінілін, піридин, N-метилпіридин, N, N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Також можливо працювати за відсутності додаткового конденсувального агента або

застосовувати надлишок амінного компонента, так що він одночасно діє як кислотна зв'язуюча речовина.

Відповідно до іншого аспекту винаходу забезпечений спосіб P2 одержання похідних карбонової кислоти формули (III), в якій Т означає О, який проілюстрований такою схемою реакції:



Спосіб P2

де X² має визначене тут значення;

5-хлор-3-(диформетил)-1-метил-1H-піразол-4-карбальдегід відомий з WO-2004/014138 (довідковий приклад 35).

Стадію 1 способу P2 проводять у присутності окислювача та, за потреби, у присутності розчинника.

Стадії 2 і 5 способу P2 проводять у присутності галоїдної кислоти та, за потреби, у присутності розчинника.

Стадію 3 способу P2 проводять у присутності фторувального агента та, за потреби, у присутності розчинника.

Стадію 4 способу P2 проводять у присутності кислоти або основи та, за потреби, у присутності розчинника.

Підходящі окислювачі для здійснення стадії 1 способу P2 за винаходом у кожному разі всі є неорганічними та органічними окислювачами, які є звичними для таких реакцій. Перевагу надають використанню перманганату бензилтріетиламонію, бром, хлору, m-хлорпербензойної кислоти, хромової кислоти, оксиду хрому (VI), пероксиду водню, пероксиду водню-трифториду бору, пероксиду водню-сечовини, 2-гідроксипероксигексафтор-2-пропанолу; йоду, киснево-платинового каталізатора, пербензойної кислоти, пероксіяцетилнітрату, перманганату калію, рутенату калію, дихромату піридинію, оксиду рутенію (VIII), оксиду срібла (I), оксиду срібла (II), нітриту срібла, хлориту натрію, гіпохлориту натрію або 2,2,6,6-тетраметилпіперидин-1-оксиду.

Підходящі галоїдні кислоти для здійснення стадій 2 і 5 способу P2 за винаходом у кожному разі всі є органічними або неорганічними галоїдними кислотами, які є звичними для таких реакцій. Перевагу надають особливо використанню фосгену, фосфористого трихлориду, фосфористого пентахлориду, фосфористого трихлоридоксиду, тіонілхлориду або тетрафторид-трифенілфосфіну вуглецю.

Підходящим фторувальним агентом для здійснення стадії 3 способу P2 за винаходом у кожному разі є всі фторувальні агенти, які є звичними для таких реакцій. Перевагу надають використанню фториду цезію, фториду калію, фториду калію-дифториду кальцію або фториду тетрабутиламонію.

При здійсненні стадій 1-5 способу P2 за винаходом температури реакцій можуть незалежно коливатися в межах відносно широкого діапазону. Звичайно, спосіб за винаходом проводять при температурах від 0 °C до 160 °C, краще від 10 °C до 120 °C. Способом контролювання температури способів за винаходом є застосування мікрохвильової технології.

Стадії 1-5 способу P2 за винаходом звичайно незалежно проводять при атмосферному тиску. Однак, у кожному разі також можливо працювати при підвищеному або зниженому тиску.

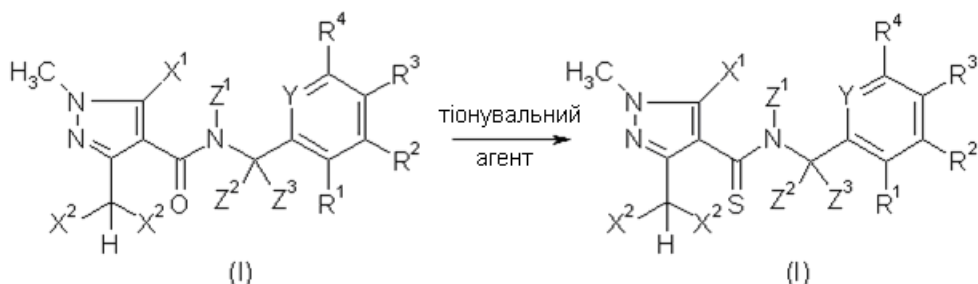
При здійсненні стадії 1 способу P2 за винаходом звичайно використовують один моль або надлишкову кількість окислювача на моль альдегіду формули (IV). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

При здійсненні стадій 2 і 5 способу P2 за винаходом звичайно використовують один моль або надлишкову кількість галоїдної кислоти на моль кислоти формули (IIIa) або (IIIb). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

При здійсненні стадії 3 способу P2 за винаходом звичайно використовують один моль або надлишкову кількість фторувального агента на моль кислотного хлориду (IIIb). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

При здійсненні стадії 4 способу P2 за винаходом звичайно використовують один моль або надлишкову кількість кислоти або основи на моль фториду кислоти (IIIc). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

Відповідно до іншого аспекту цього винаходу забезпечений спосіб P3 одержання сполуки формули (I), в якій T означає S, починаючи зі сполуки формули (I), в якій T означає O, який проілюстрований наведеною нижче схемою реакції:



Спосіб P3

де X^1 , X^2 , Z^1 , Z^2 , Z^3 , Y, R^1 , R^2 , R^3 і R^4 мають визначені тут значення, у необов'язковій присутності каталітичної або стехіометричної чи надлишкової кількості основи, такої як неорганічна та органічна основа. Перевагу надають використанню карбонатів лужних металів, таких як карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію; гетероциклічних ароматичних основ, таких як піридин, піколін, лютидин, колідин; а також третинних амінів, таких як триметиламін, тріетиламін, трибутиламін, N, N-диметиланілін, N, N-диметиламінопіридин або N-метил-піперидин.

Спосіб P3 за винаходом проводять у присутності тіонувального агента.

Вихідні амідні похідні формули (I) можуть бути одержані відповідно до способу P1.

Підходящими тіонувальними агентами для здійснення способу P3 за винаходом можуть бути сірка (S), сульфгідрильна кислота (H_2S), сульфід натрію (Na_2S), гідросульфід натрію ($NaHS$), трисульфід бору (B_2S_3), сульфід біс(діетиламінію) ($(AlEt_2)_2S$), сульфід амонію ($(NH_4)_2S$), фосфористий пентасульфід (P_2S_5), реактив Лавсона (2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,2,3,4-дитіадифосфетан 2,4-дисульфід) або тіонувальний агент на полімерній підложці, такий як ті, що описані в Journal of the Chemical Society ("Журнал хімічного співтовариства"), Perkin 1 (2001), 358.

Виділення продукту реакції проводять традиційними методами. Звичайно реакційну суміш обробляють водою і відокремлюють органічну фазу, а після висушування її концентрують при зниженому тиску. Якщо це є доречним, осад, що залишається, може бути вивільнений традиційними методами, такими як хроматографія, рекристалізація або дистиляція, від будь-яких домішок, які все ще можуть бути присутніми.

Сполука за цим винаходом може бути одержана загальними способами одержання, описаними вище. Незважаючи на це, буде зрозумілим, що на підставі загального знання і доступних публікацій спеціаліст зможе адаптувати ці способи відповідно до специфіки кожної зі сполук, які необхідно синтезувати.

В іншому аспекті цей винахід також стосується фунгіцидної композиції, яка містить ефективну і нефітотоксичну кількість активної сполуки формули (I).

Вираз "ефективна і нефітотоксична кількість" означає кількість композиції відповідно до винаходу, яка є достатньою для боротьби з грибами або їх знищення, що присутні на культурах рослин або поява яких на них є ймовірною, і яка не викликає будь-яких істотних симптомів фітотоксичності для згаданих культур рослин. Така кількість може варіюватись у межах широкого діапазону залежно від грибів, з якими необхідно боротися, типу культур, кліматичних

умов і сполук, що входять до складу фунгіцидної композиції відповідно до винаходу. Ця кількість може бути визначена систематичними польовими випробуваннями, можливість проведення яких є доступною для спеціаліста у цій галузі.

Отже, відповідно до винаходу забезпечена фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки формули (I), як визначено тут, і прийнятні для сільського господарства підложку, носій або наповнювач.

Відповідно до винаходу термін "підложка" позначає природну або синтетичну, органічну або неорганічну сполуку, з якою поєднують або асоціюють активну сполуку формули (I) для того, аби полегшити її нанесення, особливо на частини рослин. З огляду на це ця підложка звичайно є інертною і повинна бути прийнятною для сільського господарства. Підложка може бути твердою або рідкою. Прикладами підходящих підложок є глина, природні або синтетичні силікати, кремнезем, смоли, віск, тверді добрива, вода, спирти, зокрема бутанол, органічні розчинники, мінеральні й рослинні олії та їхні похідні. Також можуть бути використані суміші таких підложок.

Композиція відповідно до винаходу також може містити додаткові компоненти. Зокрема, композиція може додатково містити поверхнево-активну речовину. Поверхнево-активна речовина може бути емульгатором, агентом диспергування або зволожувальним агентом іонного або неіонного типу або сумішшю таких поверхнево-активних речовин. Можна зазначити, наприклад, солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонові кислоти, солі фенолсульфонові або нафталенсульфонові кислоти, поліконденсати етиленоксиду з жирними спиртами або з жирними кислотами або з жирними амінами, заміщені феноли (зокрема, алкілфеноли або арилфеноли), солі складних ефірів сульфобурштинової кислоти, тауринові похідні (зокрема, алкілтаурати), фосфорні складні ефіри поліоксietильованих спиртів або фенолів, складні ефіри жирних кислот поліолів та похідні вищезазначених сполук, які містять сульфатні, сульфонатні та фосфатні функції. Присутність принаймні однієї поверхнево-активної речовини звичайно є важливою, коли активна сполука та/або інертна підложка є водонерозчинними і коли векторний агент для застосування є водою. У кращому варіанті вміст поверхнево-активної речовини може становити від 5 % до 40 % за вагою композиції.

Необов'язково можуть бути також введені додаткові компоненти, наприклад, захисні колоїди, адгезиви, згущувачі, тиксотропні агенти, агенти просочування, стабілізатори, комплексоутворювальні сполуки. У більшості випадків активні сполуки можуть бути поєднані з будь-якою твердою або рідкою добавкою, що відповідає звичайним технологіям приготування композицій.

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

Композиції відповідно до винаходу можуть бути використані у різних формах, таких як аерозольний розподільний пристрій, капсульна суспензія, концентрат холодного туману, пилоподібний порошок, емульгований концентрат, емульсія олія-у-воді, емульсія вода-в-олії, інкапсульована гранула, дрібна гранула, текучий концентрат для обробки насіння, газ (під тиском), газоутворювальний продукт, гранули, концентрат гарячого туману, макрогранули, мікрогранули, порошок, здатний до диспергування в олії, змішуваний з олією текучий концентрат, змішувана з олією рідина, паста, рослинні палички, порошок для обробки сухого насіння, насіння, покриті пестицидом, розчинний концентрат, розчинний порошок, розчин для обробки насіння, концентрат суспензії (текучий концентрат), рідина з ультранизьким об'ємом (ULV), суспензія з ультранизьким об'ємом (ULV), гранули і таблетки, здатні до диспергування у воді, порошок, здатний до диспергування у воді, для обробки рідким розчином (суспензією), водорозчинні гранули або таблетки, водорозчинний порошок для обробки насіння і змочуваний порошок. До цих композицій відносяться не лише композиції, що є готовими для нанесення на рослину або насіння для обробки за допомогою підходящого пристрою, такого як пристрій для розбризкування або обприскування, але також концентровані комерційні композиції, які мають бути розведені до нанесення на культури рослин.

Сполуки відповідно до винаходу також можуть бути змішані з однією або більше активною речовиною інсектициду, фунгіциду, бактерициду, аттрактанту, акарициду чи феромону або іншими сполуками з біологічною активністю. Звичайно одержані таким чином суміші мають розширений спектр активності. Сумішам з іншими фунгіцидними сполуками надають особливу перевагу.

Приклади підходящих фунгіцидних партнерів для змішування можуть бути вибрані з таких переліків:

(1) інгібітори біосинтезу ергостерину, наприклад (1.1) альдиморф (1704-28-5), (1.2) азаконазол (60207-31-0), (1.3) бітертанол (55179-31-2), (1.4) бромуконазол (116255-48-2), (1.5)

- ципроконазол (113096-99-4), (1.6) диклобутразол (75736-33-3), (1.7) дифеноконазол (119446-68-3), (1.8) диніконазол (83657-24-3), (1.9) диніконазол-М (83657-18-5), (1.10) додеморф (1593-77-7), (1.11) додеморфацетат (31717-87-0), (1.12) епоксиконазол (106325-08-0), (1.13) етаконазол (60207-93-4), (1.14) фенаримол (60168-88-9), (1.15) фенбуконазол (114369-43-6), (1.16) фенгексамід (126833-17-8), (1.17) фенпропідин (67306-00-7), (1.18) фенпропіморф (67306-03-0), (1.19) флухінконазол (136426-54-5), (1.20) флурпримідол (56425-91-3), (1.21) флусилазол (85509-19-9), (1.22) флутріафол (76674-21-0), (1.23) фурконазол (112839-33-5), (1.24) фурконазол-цис (112839-32-4), (1.25) гексаконазол (79983-71-4), (1.26) імазаліл (60534-80-7), (1.27) імазаліл сульфат (58594-72-2), (1.28) імібенконазол (86598-92-7), (1.29) іпконазол (125225-28-7), (1.30) метконазол (125116-23-6), (1.31) міклобутаніл (88671-89-0), (1.32) нафтифін (65472-88-0), (1.33) нуаримол (63284-71-9), (1.34) окспоконазол (174212-12-5), (1.35) паклобутразол (76738-62-0), (1.36) пефуразоат (101903-30-4), (1.37) пенконазол (66246-88-6), (1.38) піпералін (3478-94-2), (1.39) прохлораз (67747-09-5), (1.40) пропіконазол (60207-90-1), (1.41) протіоконазол (178928-70-6), (1.42) пірибутикарб (88678-67-5), (1.43) пірифенокс (88283-41-4), (1.44) хінконазол (103970-75-8), (1.45) симеконазол (149508-90-7), (1.46) спіроксамін (118134-30-8),
- (1.47) тебуконазол (107534-96-3), (1.48) тербінафін (91161-71-6), (1.49) тетраконазол (112281-77-3), (1.50) тріадимефон (43121-43-3), (1.51) тріадименол (89482-17-7), (1.52) тридеморф (81412-43-3), (1.53) трифлумізол (68694-11-1), (1.54) трифорин (26644-46-2), (1.55) тритиконазол (131983-72-7), (1.56) уніконазол (83657-22-1), (1.57) уніконазол-р (83657-17-4), (1.58) вініконазол (77174-66-4), (1.59) вориконазол (137234-62-9), (1.60) 1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-тріазол-1-іл)циклогептанол (129586-32-9), (1.61) метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл)-1H-імідазол-5-карбоксилат (110323-95-0), (1.62) N'-{5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсиліл)пропокси]феніл}-N-етил-N-метилімідоформамід, (1.63) N-етил-N-метил-N'-{2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-(триметилсиліл)пропокси]феніл} імідоформамід і (1.64) O-[1-(4-метоксифенокси)-3,3-диметилбутан-2-іл] 1H-імідазол-1-карботіоат (111226-71-2);
- (2) інгібітори дихального ланцюга в комплексі I або II, наприклад (2.1) бікасафен (581809-46-3), (2.2) боскалід (188425-85-6), (2.3) карбоксин (5234-68-4), (2.4) дифлуметорим (130339-07-0), (2.5) фенфурам (24691-80-3), (2.6) флуопірам (658066-35-4), (2.7) флутоланіл (66332-96-5), (2.8) флуксапіроксад (907204-31-3), (2.9) фураметпір (123572-88-3), (2.10) фурмециклокс (60568-05-0), (2.11) ізопіразам (суміш син-епімерного рацемату 1RS, 4SR, 9RS та анти-епімерного рацемату 1RS, 4SR, 9SR) (881685-58-1), (2.12) ізопіразам (анти-епімерний рацемат 1RS, 4SR, 9SR), (2.13) ізопіразам (анти-епімерний енантіомер 1R, 4S, 9S), (2.14) ізопіразам (анти-епімерний енантіомер 1S, 4R, 9R), (2.15) ізопіразам (син-епімерний рацемат 1RS, 4SR, 9RS), (2.16) ізопіразам (син-епімерний енантіомер 1R, 4S, 9R), (2.17) ізопіразам (син-епімерний енантіомер 1S, 4R, 9S), (2.18) мепроніл (55814-41-0), (2.19) оксикарбоксин (5259-88-1), (2.20) пенфлуфен (494793-67-8), (2.21) пентіопірад (183675-82-3), (2.22) седаксан (874967-67-6), (2.23) тифлузамід (130000-40-7), (2.24) 1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-3-(трифторметил)-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.25) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.26) 3-(дифторметил) -N-[4-фтор-2-(1,1,2,3,3,3-гексафторпропокси)феніл]-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.27) N-[1-(2,4-дихлорфеніл)-1-метоксипропан-2-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід (1092400-95-7) (WO 2008148570), (2.28) 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-[[4-(трифторметил)піридин-2-іл]окси]феніл)етил]хіназолін-4-амін (1210070-84-0) (WO2010025451), (2.29) N-[9-(дихлорметил)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метаннафтален-5-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.30) N-[(1S, 4R)-9-(дихлорметил)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метаннафтален-5-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід і (2.31) N-[(1R, 4S)-9-(дихлорметил)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метаннафтален-5-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід;
- (3) інгібітори дихального ланцюга в комплексі III, наприклад (3.1) аметоктрадин (865318-97-4), (3.2) амисульбром (348635-87-0), (3.3) азоксистробін (131860-33-8), (3.4) ціазофамід (120116-88-3), (3.5) коуметоксистробін (850881-30-0), (3.6) коумоксистробін (850881-70-8), (3.7) димоксистробін (141600-52-4), (3.8) енестробиурин (238410-11-2) (WO 2004/058723), (3.9) фамоксадон (131807-57-3) (WO 2004/058723), (3.10) фенамідон (161326-34-7) (WO 2004/058723), (3.11) феноксистробін (918162-02-4), (3.12) флуоксастробін (361377-29-9) (WO 2004/058723), (3.13) крезоксим-метил (143390-89-0) (WO 2004/058723), (3.14) метоміностробін (133408-50-1) (WO 2004/058723), (3.15) оризастробін (189892-69-1) (WO 2004/058723), (3.16) пікоксистробін (117428-22-5) (WO 2004/058723), (3.17) піраклостробін (175013-18-0) (WO 2004/058723), (3.18) піраметостробін (915410-70-7) (WO 2004/058723), (3.19) піраоксистробін (862588-11-2) (WO 2004/058723), (3.20) пірибенкарб (799247-52-2) (WO 2004/058723), (3.21)

триклопірикарб (902760-40-1), (3.22) трифлористробін (141517-21-7) (WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-хлор-2-метилфеноксид)-5-фторпіримідин-4-іл]окси]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід (WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(метоксиіміно)-N-метил-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден]амін]окси]метил]феніл)етанамід (WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(метоксиіміно)-N-метил-2-[2-[(E)-{(1-[3-(трифторметил)феніл]етокси)іміно}метил]феніл]етанамід (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-(3-[(E)-1-фтор-2-фенілетеніл]окси]феніл)етиліден]амін]окси]метил]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-[2-[[[(2E, 3E)-4-(2,6-дихлорфеніл)бут-3-ен-2-іліден]амін]окси]метил]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід, (3.28) 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)піридин-3-карбоксамід (119899-14-8), (3.29) 5-метокси-2-метил-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден]амін]окси]метил]феніл)-2,4-дигідро-3H-1,2,4-тріазол-3-он, (3.30) метил (2E)-2-[2-[[[циклопропіл[4-метоксифеніл]іміно]метил]сульфаніл]метил]феніл)-3-метоксипроп-2-еноат (149601-03-6), (3.31) N-(3-етил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-(форміламін)-2-гідроксibenзамід (226551-21-9), (3.32) 2-[2-[(2,5-диметилфеноксид)метил]феніл)-2-метокси-N-метилацетамід (173662-97-0) і (3.33) (2R)-2-[2-[(2,5-диметилфеноксид)метил]феніл)-2-метокси-N-метилацетамід (394657-24-0);

(4) інгібітори мітозу та поділу клітин, наприклад (4.1) беноміл (17804-35-2), (4.2) карбендазим (10605-21-7), (4.3) хлорфеназол (3574-96-7), (4.4) діетофенкарб (87130-20-9), (4.5) етабоксам (162650-77-3), (4.6) флуопіколід (239110-15-7), (4.7) фуберидазол (3878-19-1), (4.8) пенцикурон (66063-05-6), (4.9) тіабендазол (148-79-8), (4.10) тіофанат-метил (23564-05-8), (4.11) тіофанат (23564-06-9), (4.12) зоксамід (156052-68-5), (4.13) 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифторфеніл) [1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин (214706-53-3) і (4.14) 3-хлор-5-(6-хлорпіридин-3-іл)-6-метил-4-(2,4,6-трифторфеніл)піридазин (1002756-87-7);

(5) сполуки, здатні мати багатоцентрову дію, як, наприклад, (5.1) бордоська суміш (8011-63-0), (5.2) каптафол (2425-06-1), (5.3) каптан (133-06-2) (WO 02/12172), (5.4) хлорталоніл (1897-45-6), (5.5) гідроксид міді (20427-59-2), (5.6) нафтенат міді (1338-02-9), (5.7) оксид міді (1317-39-1), (5.8) оксихлорид міді (1332-40-7), (5.9) сульфат міді(2+) (7758-98-7), (5.10) дихлофлуанід (1085-98-9), (5.11) дитіанон (3347-22-6), (5.12) додин (2439-10-3), (5.13) вільна основа додину, (5.14) фербам (14484-64-1), (5.15) фторфолпет (719-96-0), (5.16) фолпет (133-07-3), (5.17) гуазатин (108173-90-6), (5.18) гуазатинацетат, (5.19) іміноктадин (13516-27-3), (5.20) іміноктадин альбесилат (169202-06-6), (5.21) іміноктадинтріацетат (57520-17-9), (5.22) манкопер (53988-93-5), (5.23) манкозеб (8018-01-7), (5.24) манеб (12427-38-2), (5.25) метирам (9006-42-2), (5.26) метирам цинк (9006-42-2), (5.27) оксин-мідь (10380-28-6), (5.28) пропамідин (104-32-5), (5.29) пропінеб (12071-83-9), (5.30) сірка і препарати сірки, включаючи полісульфід кальцію (7704-34-9), (5.31) тирам (137-26-8), (5.32) толілфлуанід (731-27-1), (5.33) зинеб (12122-67-7) і (5.34) зирам (137-30-4);

(6) сполуки, здатні індукувати імунний захист, як, наприклад, (6.1) ацибензолар-S-метил (135158-54-2), (6.2) ізотіаніл (224049-04-1), (6.3) пробеназол (27605-76-1) і (6.4) тіадиніл (223580-51-6);

(7) інгібітори біосинтезу амінокислот та/або білка, наприклад (7.1) андоприм (23951-85-1), (7.2) бластицидин-S (2079-00-7), (7.3) ципродиніл (121552-61-2), (7.4) касугаміцин (6980-18-3), (7.5) гідрат гідрохлориду касугаміцину (19408-46-9), (7.6) мепаніпірим (110235-47-7), (7.7) піриметаніл (53112-28-0) та (7.8) 3-(5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-3,4-дигідроізохінолін-1-іл)хінолін (861647-32-7) (WO2005070917);

(8) інгібітори вироблення АТФ, наприклад (8.1) ацетат фентину (900-95-8), (8.2) хлорид фентину (639-58-7), (8.3) гідроксид фентину (76-87-9) і (8.4) силтіофам (175217-20-6);

(9) інгібітори синтезу стінок клітин, наприклад (9.1) бентіавалікарб (177406-68-7), (9.2) диметоморф (110488-70-5), (9.3) флуморф (211867-47-9), (9.4) іпровалікарб (140923-17-7), (9.5) мандипропамід (374726-62-2), (9.6) поліоксини (11113-80-7), (9.7) поліоксорим (22976-86-9), (9.8) валідаміцин А (37248-47-8) і (9.9) валіфеналат (283159-94-4; 283159-90-0);

(10) інгібітори ліпідного та мембранного синтезу, наприклад (10.1) біфеніл (92-52-4), (10.2) хлорнеб (2675-77-6), (10.3) диклоран (99-30-9), (10.4) едифенфос (17109-49-8), (10.5) етридіазол (2593-15-9), (10.6) йодокарб (55406-53-6), (10.7) іпробенфос (26087-47-8), (10.8) ізопротіолан (50512-35-1), (10.9) пропамокарб (25606-41-1), (10.10) пропамокарб гідрохлорид (25606-41-1), (10.11) протіокарб (19622-08-3), (10.12) піразофос (13457-18-6), (10.13) хінтозен (82-68-8), (10.14) текназен (117-18-0) і (10.15) толклофос-метил (57018-04-9);

(11) інгібітори біосинтезу меланіну, наприклад (11.1) карпропамід (104030-54-8), (11.2) диклоцимет (139920-32-4), (11.3) феноксаніл (115852-48-7), (11.4) фталід (27355-22-2), (11.5) пірохілон (57369-32-1), (11.6) трициклазол (41814-78-2) та (11.7) 2,2,2-трифторетил {3-метил-1-[(4-метилбензоіл)амін]бутан-2-іл}карбамат (851524-22-6) (WO2005042474);

(12) інгібітори синтезу нуклеїнових кислот, наприклад (12.1) беналаксил (71626-11-4), (12.2) беналаксил-М (кіралаксил) (98243-83-5), (12.3) бупіримат (41483-43-6), (12.4) клозилакзон (67932-85-8), (12.5) диметиримол (5221-53-4), (12.6) етиримол (23947-60-6), (12.7) фуралаксил (57646-30-7), (12.8) гімексазол (10004-44-1), (12.9) металаксил (57837-19-1), (12.10) металаксил-М (мефеноксам) (70630-17-0), (12.11) офураза (58810-48-3), (12.12) оксадиксил (77732-09-3) та (12.13) оксолінова кислота (14698-29-4);

(13) інгібітори сигнальної трансдукції, наприклад (13.1) хлосолінат (84332-86-5), (13.2) фенпиклоніл (74738-17-3), (13.3) флудіоксоніл (131341-86-1), (13.4) іпродіон (36734-19-7), (13.5) процимідон (32809-16-8), (13.6) хіноксифен (124495-18-7) та (13.7) вінклозолін (50471-44-8);

(14) сполуки, здатні діяти як роз'єднувальний агент, як, наприклад, (14.1) бінапакрил (485-31-4), (14.2) динокап (131-72-6), (14.3) феримзон (89269-64-7), (14.4) флуазинам (79622-59-6) і (14.5) мептилдинокап (131-72-6);

(15) інші сполуки, як, наприклад, (15.1) бентіазол (21564-17-0), (15.2) бетоксацин (163269-30-5), (15.3) капсимицин (70694-08-5), (15.4) карвон (99-49-0), (15.5) хінометіонат (2439-01-2), (15.6) піріофенон (хлазафенон) (688046-61-9), (15.7) цуфранеб (11096-18-7), (15.8) цифлуфенамід (180409-60-3), (15.9) цимоксаніл (57966-95-7), (15.10) ципросульфамід (221667-31-8), (15.11) дазомет (533-74-4), (15.12) дебакарб (62732-91-6), (15.13) дихлорфен (97-23-4), (15.14) дикломезин (62865-36-5), (15.15) дифензокват (49866-87-7), (15.16) дифензокват метилсульфат (43222-48-6), (15.17) дифеніламін (122-39-4), (15.18) екомат,

(15.19) фенпіразамін (473798-59-3), (15.20) флуметовер (154025-04-4), (15.21) фторимід (41205-21-4), (15.22) флусульфамід (106917-52-6), (15.23) флутіаніл (304900-25-2), (15.24) фозетил-алюміній (39148-24-8), (15.25) фозетил-кальцій, (15.26) фозетил-натрій (39148-16-8), (15.27) гексахлорбензол (118-74-1), (15.28) ірумаміцин (81604-73-1), (15.29) метасульфокарб (66952-49-6), (15.30) метилізотіоціанат (556-61-6), (15.31) метрафенон (220899-03-6), (15.32) мілдіоміцин (67527-71-3), (15.33) натаміцин (7681-93-8), (15.34) диметилдитіокарбамат нікелю (15521-65-0), (15.35) нітротал-ізопропіл (10552-74-6), (15.36) октилінон (26530-20-1), (15.37) оксамокарб (917242-12-7), (15.38) оксифентіїн (34407-87-9), (15.39) пентахлорфенол і солі (87-86-5), (15.40) фенотрин, (15.41) фосфориста кислота та її солі (13598-36-2), (15.42) пропамокарб-фозетилат, (15.43) пропанозин-натрій (88498-02-6), (15.44) прохіназид (189278-12-4), (15.45) піриморф (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-терт-бутилфеніл)-3-(2-хлорпіридин-4-іл)-1-(морфолін-4-іл)проп-2-ен-1-он (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-терт-бутилфеніл)-3-(2-хлорпіридин-4-іл)-1-(морфолін-4-іл)проп-2-ен-1-он (1231776-29-6), (15.46) піролнітрин (1018-71-9) (EP-A 1 559 320), (15.47) тебуффлохін (376645-78-2), (15.48) теклофталам (76280-91-6), (15.49) толніфанід (304911-98-6), (15.50) тріазоксид (72459-58-6), (15.51) трихлорамід (70193-21-4), (15.52) зариламід (84527-51-5), (15.53) 3S, 6S, 7R, 8R)-8-бензил-3-[(3-[(ізобутирилокси)метокси]-4-метоксипіридин-2-іл)карбоніл)амін]-6-метил-4,9-діоксо-1,5-діоксон-7-іл 2-метилпропаноат (517875-34-2) (WO2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003319-79-6) (WO 2008013622), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003319-80-9) (WO 2008013622), (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003318-67-9) (WO 2008013622), (15.57) 1-(4-метоксифенокси)-3,3-диметилбутан-2-іл 1Н-імідазол-1-карбоксилат (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин (13108-52-6), (15.59) 2,3-дибутил-6-хлортієно[2,3-d]піримідин-4(3H)-он (221451-58-7), (15.60) 2,6-диметил-1Н, 5Н-[1,4]дитііно[2,3-с:5,6-с']дипірол-1,3,5,7(2H, 6H)-тетрон, (15.61) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-[(5R)-5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)етанон (1003316-53-7) (WO 2008013622), (15.62) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-[(5S)-5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)етанон (1003316-54-8) (WO 2008013622), (15.63) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-[(5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл)-1,3-тіазол-2-іл]піперидин-1-іл}етанон (1003316-51-5) (WO 2008013622), (15.64) 2-бутоксид-6-йод-3-пропіл-4Н-хромен-4-он, (15.65) 2-хлор-5-[2-хлор-1-(2,6-дифтор-4-метоксифеніл)-4-метил-1Н-імідазол-5-іл]піридин, (15.66) 2-фенілфенол та солі (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-трифтор-3,3-диметил-3,4-дигідроізохінолін-1-іл)хінолін (861647-85-0) (WO2005070917), (15.68) 3,4,5-трихлорпіридин-2,6-дикарбонітрил (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметил-1,2-оксазолідин-3-іл]піридин, (15.70) 3-хлор-5-(4-хлорфеніл)-4-(2,6-дифторфеніл)-6-метилпіридазин, (15.71) 4-(4-хлорфеніл)-5-(2,6-дифторфеніл)-3,6-диметилпіридазин, (15.72) 5-амін-1,3,4-тіадіазол-2-тіол, (15.73) 5-хлор-N'-феніл-N'-(проп-2-ін-1-іл)тіофен-2-сульфонгідрозид (134-31-6), (15.74) 5-фтор-2-[(4-фторбензил)окси]піримідин-4-амін (1174376-11-4) (WO2009094442), (15.75) 5-фтор-2-[(4-метилбензил)окси]піримідин-4-амін

(1174376-25-0) (WO2009094442), (15.76) 5-метил-6-октил[1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин-7-амін, (15.77) етил (2Z)-3-амін-2-ціан-3-фенілпроп-2-еноат, (15.78) N'-(4-{[3-(4-хлорбензил)-1,2,4-тіадіазол-5-іл]окси}-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилімідоформамід, (15.79) N-(4-хлорбензил)-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, (15.80) N-[(4-хлорфеніл)(ціано)метил]-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, (15.81) N-[(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)метил]-2,4-дихлорпіридин-3-карбоксамід, (15.82) N-[1-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2,4-дихлорпіридин-3-карбоксамід, (15.83) N-[1-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2-фтор-4-йодпіридин-3-карбоксамід, (15.84) N-[(E)-[(циклопропілметокси)іміно][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл] метил]-2-фенілацетамід (221201-92-9), (15.85) N-[(Z)-[(циклопропілметокси)іміно][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл]метил]-2-фенілацетамід (221201-92-9), (15.86) N'-[4-{[3-терт-бутил-4-ціано-1,2-тіазол-5-іл]окси}-2-хлор-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформамід, (15.87) N-метил-2-(1-{[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]ацетил}піперидин-4-іл)-N-(1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-49-6) (WO 2007014290), (15.88) N-метил-2-(1-{[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]ацетил}піперидин-4-іл)-N-[(1R)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-07-6) (WO 2007014290), (15.89) N-метил-2-(1-{[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]ацетил}піперидин-4-іл)-N-[(1S)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-48-5) (WO 2007014290), (15.90) пентил {6-[[[(1-метил-1H-тетразол-5-іл)(феніл)метиліден] амін]окси]метил}піридин-2-іл}карбамат, (15.91) феназин-1-карбонова кислота, (15.92) хінолін-8-ол(134-31-6), (15.93) хінолін-8-ол сульфат (2:1) (134-31-6) та (15.94) терт-бутил {6-[[[(1-метил-1H-тетразол-5-іл)(феніл)метиліден]амін]окси] метил}піридин-2-іл}карбамат; (16) інші сполуки, наприклад, (16.1) 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1H-піразол-4-карбоксамід, (16.2) N-(4'-хлорбіфеніл-2-іл)-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (16.3) N-(2',4'-дихлор-біфеніл-2-іл)-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (16.4) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[4'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1H-піразол-4-карбоксамід, (16.5) N-(2',5'-дифторбіфеніл-2-іл)-1-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-4-карбоксамід, (16.6) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.7) 5-фтор-1,3-диметил-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.8) 2-хлор-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.9) 3-(дифторметил)-N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.10) N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.11) 3-(дифторметил)-N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.12) N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.13) 2-хлор-N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.14) 2-хлор-N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.15) 4-(дифторметил)-2-метил-N-[4'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1,3-тіазол-5-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.16) 5-фтор-N-[4'-(3-гідрокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.17) 2-хлор-N-[4'-(3-гідрокси-3-метилбут-1-ін-1-іл) біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.18) 3-(дифторметил)-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.19) 5-фтор-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.20) 2-хлор-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл) біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.21) (5-бром-2-метокси-4-метилпіридин-3-іл)(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)метанон (відомий з EP-A 1 559 320), (16.22) N-[2-(4-{[3-(4-хлорфеніл)проп-2-ін-1-іл]окси}-3-метоксифеніл)етил]-N2-(метилсульфоніл)валінамід (220706-93-4), (16.23) 4-оксо-4-[(2-фенілетил)амін] бутанова кислота та (16.24) бут-3-ін-1-іл {6-[[[(Z)-(1-метил-1H-тетразол-5-іл)(феніл)метиліден]амін]окси]метил}піридин-2-іл}карбамат.

Всі вказані партнери для змішування з (1) по (16) класи можуть, якщо це дозволяють їхні функціональні групи, необов'язково утворювати солі з підходящими основами або кислотами.

Приклади підходящих бактерицидних, інсектицидних, акарицидних або нематодіцидних партнерів для змішування можуть бути вибрані з таких переліків:

Бактерициди:

Бронопол, дихлорфен, нітрапірин, диметилдитіокарбамат нікелю, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші препарати міді.

Інсектициди/акарициди/нематодіциди:

(1) інгібітори ацетилхолінестерази (AChE), наприклад:

карбамати, наприклад, аланікарб, альдікарб, бендіокарб, бенфуракарб, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, етіофенкарб, фенобукарб, форметанат, фураціокарб, ізопрокарб, метіокарб, метоміл, метолкарб, оксаміл, піримікарб,

пропоксур, тіодикарб, тіофанокс, тріазамат, триметакарб, ХМС та ксилілкарб; або
органофосфати, наприклад, ацефат, азаметіофос, азинфос-етил, азинфос-метил, кадусафос, хлоретоксифос, хлорфенвінфос, хлормефос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, кумафос, ціанофос, деметон-S-метил, діазинон, дихлорвос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвінфос, дисульфотон, EPN, етіон, етопрофос, фамфур, фенаміфос, фенітротіон, фентіон, фостіазат, гептенофос, іміціяфос, ізофенфос, ізопропіл О-(метоксіамінотіо-фосфорил) саліцилат, ізоксатіон, малатіон, мекарбам, метамідофос, метидатіон, мевінфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратіон, паратіон-метил, фентоат, форат, фозалон, фосмет, фосфамідон, фоксим, піриміфос-метил, профенофос, пропетамфос, протіофос, піраклофос, піридафентіон, хіналфос, сульфотеп, тебупірімфос, темефос, тербуфос, тетраклорвінфос, тіометон, тріазофос, трихлорфон та вамідотіон;

(2) антагоністи GABA-стробованого хлоридного каналу, наприклад:

органохлорини циклодієну, наприклад, хлордан та ендосульфат; або

фенілпіразоли (фіпроли), наприклад, етипрол і фіпроніл;

(3) модулятори натрієвого каналу / блокатори натрієвого каналу, залежні від напруги, наприклад:

піретроїди, наприклад, акринатрин, алетрин, d-цис-транс алетрин, d-транс алетрин, біфентрин, біоалетрин, ізомер біоалетрин S-циклопентенілу, біорезметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гама-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин [(1R)-транс ізомери], дельтаметрин, емпентрин [(EZ)-(1R) ізомери], есфенвалерат, етофенпрокс, фенпропатрин, фенфалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флувалінат, халфенпрокс, іміпротрин, кадетрин, перметрин, фенотрин [(1R)-транс ізомер], пралетрин, піретрин (піретрум), резметрин, силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тетраметри [(1R) ізомери], тралометрин і трансфлутрин; або

DDT; або метоксихлор;

(4) агоністи нікотинного ацетилхолінового рецептору (nAChR), наприклад:

неонікотиніди, наприклад, ацетаміпрід, клотіанідин, динотефуран, імідаклопрід, нітенпірам, тіаклопрід і тіаметоксам; або

нікотин;

(5) алостеричні активатори нікотинного ацетилхолінового рецептору (nAChR), наприклад: спіносини, наприклад, спінеторам і спіносад;

(6) активатори хлоридного каналу, наприклад:

авермектини/мільбеміцини, наприклад, абамектин, емабектин бензоат, лепібектин і мільбектин;

(7) міміки ювенільного гормону, наприклад:

аналоги ювенільного гормону, наприклад, гідропрес, кінопрен і метопрен; або феноксикарб; або пірипроксифен.

(8) різні неспецифічні (багатоцентрові) інгібітори, наприклад:

галіди алкілів, наприклад, бромід метилу та інші галіди алкілів; або

хлорпікрин; або фторид сульфурілу; або боракс; або блювотний камінь;

(9) селективні блокатори живлення гомоптерану, наприклад, піметрозин або флонікамід;

(10) інгібітори росту кліщів, наприклад, клофентезин, гекситіазокс і дифловідазин; або етоксазол;

(11) мікробні деструктори мембран середніх кишківників, наприклад *Bacillus thuringiensis* підвид *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* підвид *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* підвид *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* підвид *tenebrionis* та білки BT культури: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1;

(12) інгібітори мітохондріальної АТФ-синтази, наприклад, діафентіурон; або

оловоорганічні майтициди, наприклад, азоциклотин, цигексатин і фенбутатиноксид; або

пропангіт; або тетрадіфон;

(13) роз'єднувачі окислювального фосфорилування через руйнування протонного градієнта, наприклад, хлорфенапір, DNOC і сульфлурамід;

(14) блокатори каналу нікотинного ацетилхолінового рецептору (nAChR), наприклад, бенсультап, картап гідрохлорид, бенсультап, картап гідрохлорид, тіоциклам і тіосультап-натрій;

(15) інгібітори біосинтезу хітину, тип 0, наприклад, бістрифлурон, хлорфлуазурон,

дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлумурон, тефлубензурон і трифлумурон;

(16) інгібітори біосинтезу хітину, тип 1, наприклад, бупрофезин;

(17) деструктори линяння, наприклад, циромазин;

5 (18) агоністи екдизонового рецептору, наприклад, хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид і тебуфенозид;

(19) агоністи октопамінового рецептору, наприклад, амітраз;

(20) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу III, наприклад, гідраметилнон; або ацехіноцил; або флуакрипірим;

10 (21) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу I, наприклад:

МЕТІ акарициди, наприклад, феназахін, фенпіроксимат, піримідифен, піридабен, тебуфенпірад і толфенпірад; або
ротенон (Derpic);

(22) залежні від напруги блокатори натрієвого каналу, наприклад, індоксакарб; або
15 метафлумізон;

(23) інгібітори ацетил CoA карбоксилази, наприклад:

похідні тетранової і тетрамової кислот, наприклад, спіродиклофен, спіромезифен і спіротетрамат;

(24) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу IV, наприклад:

20 фосфіни, наприклад, фосфід алюмінію, фосфід кальцію, фосфін і фосфід цинку; або
ціанід;

(25) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу II, наприклад, цієнопірафен;

(28) модулятори ріанодинового рецептору, наприклад:

25 діаміни, наприклад, хлорантраніліпрол і флубендіамід.

Іншими активними інгредієнтами з невідомим або невизначеним механізмом дії є, наприклад, амідофлумет, азадирахтин, бенклотіаз, бензоксимат, біфеназат, бромпропілат, хінометіонат, кріоліт, ціантраніліпрол (ціазипір), цифлуметофен, дикофол, дифловідазин, флуенсульфон, флуфенерим, флуфіпрол, флуопірам, фуфенозид, імідаклотиз, іпродіон, меперфлутрин, піридаліл, пірифлухіназон, тетраметилфлутрин та йодметан; крім того, продукти, основані на *Bacillus firmus* (у тому числі, але це не є обмеженням, штам CNCM I-1582, такі як, наприклад, VOTiVO™, BioNem), або одна з таких відомих активних сполук: 3-бром-N-(2-бром-4-хлор-6-[(1-циклопропілетил)карбамоїл]феніл)-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з WO2005/077934), 4-[[[(6-бромпіридин-3-іл)метил](2-фторетил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115644), 4-[[[(6-фторпіридин-3-іл)метил](2,2-дифторетил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115644), 4-[[[(2-хлор-1,3-тіазол-5-іл)метил](2-фторетил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115644), 4-[[[(6-хлорпіридин-3-іл)метил](2-фторетил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115644), флупірадифурон, 4-[[[(6-хлор-5-фторпіридин-3-іл)метил](метил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115643), 4-[[[(5,6-дихлорпіридин-3-іл)метил](2-фторетил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115646), 4-[[[(6-хлор-5-фторпіридин-3-іл)метил](циклопропіл)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115643), 4-[[[(6-хлорпіридин-3-іл)метил](циклопропіл)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-хлорпіридин-3-іл)метил](метил)аміно]фуран-2(5H)-он (відомий з EP-A-0 539 588), [[1-(6-хлорпіридин-3-іл)етил](метил)оксидо-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (відомий з WO2007/149134) та його діастереоізомери [[(1R)-1-(6-хлорпіридин-3-іл)етил](метил)оксидо-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (A) та [[(1S)-1-(6-хлорпіридин-3-іл)етил](метил)оксидо-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (B) (також відомий з WO2007/149134), а також сульфоксафлор та його діастереомери [(R)-метил(оксидо){(1R)-1-[6-(трифторметил)піридин-3-іл]етил}-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (A1) та [(S)-метил(оксидо){(1S)-1-[6-(трифторметил)піридин-3-іл]етил}-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (A2), які називають групою діастереомерів A (відомий з WO2010/074747, WO2010/074751), [(R)-метил(оксидо){(1S)-1-[6-(трифторметил)піридин-3-іл]етил}-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (B1) та [(S)-метил(оксидо){(1R)-1-[6-(трифторметил)піридин-3-іл]етил}-λ⁴-сульфаніліден]ціанамід (B2), які називають групою діастереомерів B (також відомою з WO2010/074747, WO2010/074751), та 11-(4-хлор-2,6-диметилфеніл)-12-гідрокси-1,4-діокса-9-азадиспіро[4.2.4.2]тетраец-11-ен-10-он (відомий з WO2006/089633), 3-(4'-фтор-2,4-диметилбіфеніл-3-іл)-4-гідрокси-8-окса-1-азаспіро[4.5]дец-3-ен-2-он (відомий з WO2008/067911), 1-{2-фтор-4-метил-5-[(2,2,2-трифторетил)сульфініл]феніл}-3-(трифторметил)-1H-1,2,4-тріазол-5-амін (відомий з WO2006/043635), [(3S, 4aR, 12R, 12aS, 12bS)-3-[(циклопропілкарбоніл)окси]-6,12-дигідрокси-4,12b-диметил-11-оксо-9-(піридин-3-іл)-1,3,4,4a, 5,6,6a, 12,12a, 12b-декагідро-2H, 11H-бензо[f]пірано[4,3-b]хромен-4-іл]метил циклопропанкарбоксилат (відомий з

WO2008/066153), 2-ціано-3-(дифторметокси)-N, N-диметилбензол-сульфонамід (відомий з WO2006/056433), 2-ціано-3-(дифторметокси)-N-метилбензолсульфонамід (відомий з WO2006/100288), 2-ціано-3-(дифторметокси)-N-етилбензолсульфонамід (відомий з WO2005/035486), 4-(дифторметокси)-N-етил-N-метил-1,2-бензотіазол-3-амін 1,1-діоксид (відомий з WO2007/057407), N-[1-(2,3-диметилфеніл)-2-(3,5-диметилфеніл)етил]-4,5-дигідро-1,3-тіазол-2-амін (відомий з WO2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-хлорфеніл)проп-2-ен-1-іл]-5-фторспіро[індол-3,4'-піперидин]-1(2H)-іл]}(2-хлорпіридин-4-іл)метанон (відомий з WO2003/106457), 3-(2,5-диметилфеніл)-4-гідрокси-8-метокси-1,8-діазаспіро [4.5]дец-3-ен-2-он (відомий з WO2009/049851), 3-(2,5-диметилфеніл)-8-метокси-2-оксо-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-іл етилкарбонат (відомий з WO2009/049851), 4-(бут-2-ин-1-ілокси)-6-(3,5-диметилпіперидин-1-іл)-5-фторпіримідин (відомий з WO2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-октафторпентил)(3,3,3-трифторпропіл)малонітрил (відомий з WO2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-октафторпентил)(3,3,4,4,4-пентафторбутил) малонітрил (відомий з WO2005/063094), 8-[2-(циклопропілметокси)-4-(трифторметил)фенокси]-3-[6-(трифторметил)піридазин-3-іл]-3-азабіцикло[3.2.1] октан (відомий з WO2007/040280), флометохін, PF1364 (CAS-реєстр. №1204776-60-2) (відомий з JP2010/018586), 5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-5-(трифторметил)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-2-(1H-1,2,4-тріазол-1-іл)бензонітрил (відомий з WO2007/075459), 5-[5-(2-хлорпіридин-4-іл)-5-(трифторметил)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-2-(1H-1,2,4-тріазол-1-іл)бензонітрил (відомий з WO2007/075459), 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-5-(трифторметил)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-2-метил-N-{2-охо-2-[(2,2,2-трифтор-етил)аміно]етил}бензамід (відомий з WO2005/085216), 4-[[6-хлорпіридин-3-іл)метил](циклопропіл)аміно]-1,3-оксазол-2(5H)-он, 4-[[6-хлорпіридин-3-іл)метил] (2,2-дифторетил)аміно]-1,3-оксазол-2(5H)-он, 4-[[6-хлорпіридин-3-іл)метил](етил)аміно]-1,3-оксазол-2(5H)-он, 4-[[6-хлорпіридин-3-іл)метил](метил)аміно]-1,3-оксазол-2(5H)-он (всі відомі з WO2010/005692), NNI-0711 (відомий з WO2002/096882), 1-ацетил-N-[4-(1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-метоксипропан-2-іл)-3-ізобутилфеніл]-N-ізобутирил-3,5-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO2002/096882), метил 2-[2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл] карбоніл)аміно]-5-хлор-3-метилбензоїл]-2-метилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2005/085216), метил 2-[2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл] карбоніл)аміно]-5-ціано-3-метил-бензоїл]-2-етилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2005/085216), метил 2-[2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл] карбоніл)аміно]-5-ціано-3-метил-бензоїл]-2-метилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2005/085216), метил 2-[3,5-дибром-2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл]карбоніл)аміно]бензоїл]-1,2-діетилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2005/085216), метил 2-[3,5-дибром-2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл]карбоніл)аміно]бензоїл]-2-етилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2005/085216), (5RS, 7RS;5RS, 7SR)-1-(6-хлор-3-піридилметил)-1,2,3,5,6,7-гексагідро-7-метил-8-нітро -5-пропоксімідазо[1,2-а]піридин (відомий з WO2007/101369), 2-{6-[2-(5-фторпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]піридин-2-іл}піримідин (відомий з WO2010/006713), 2-{6-[2-(піридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]піридин-2-іл}піримідин (відомий з WO2010/006713), 1-(3-хлорпіридин-2-іл)-N-[4-ціано-2-метил-6-(метилкарбамоїл)феніл]-3-{[5-(трифтор-метил)-1H-тетразол-1-іл]метил}-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з WO2010/069502), 1-(3-хлорпіридин-2-іл)-N-[4-ціано-2-метил-6-(метилкарбамоїл) феніл]-3-{[5-(трифторметил)-2H-тетразол-2-іл]метил}-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з WO2010/069502), N-[2-(терт-бутилкарбамоїл)-4-ціано-6-метилфеніл]-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-3-{[5-(трифторметил)-1H-тетразол-1-іл]метил}-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з WO2010/069502), N-[2-(терт-бутилкарбамоїл)-4-ціано-6-метилфеніл]-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-3-{[5-(трифторметил)-2H-тетразол-2-іл]метил}-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з WO2010/069502), (1E)-N-[(6-хлорпіридин-3-іл)метил]-N'-ціано-N-(2,2-дифторетил)етанімідамід (відомий з WO2008/009360), N-[2-(5-аміно-1,3,4-тіадіазол-2-іл)-4-хлор-6-метилфеніл]-3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-карбоксамід (відомий з CN102057925) та метил 2-[3,5-дибром-2-([3-бром-1-(3-хлорпіридин-2-іл)-1H-піразол-5-іл]карбоніл)аміно]бензоїл]-2-етил-1-метилгідразинкарбоксилат (відомий з WO2011/049233).

Також можлива суміш з іншими відомими активними сполуками, такими як гербіциди, або із добривами та регуляторами росту, антидотами чи хімічними сигнальними речовинами.

Крім того, сполуки формули (I) за винаходом також мають дуже добру антимікотичну активність. Вони мають дуже широкий антимікотичний спектр дії, зокрема, проти дерматофітів і грибів, що розмножуються бруньками, пліснявих грибів та двофазних грибів (наприклад, проти видів *Candida*, таких як *Candida albicans*, *Candida glabrata*) та видів *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*, таких як *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, видів *Trichophyton*, таких як *Trichophyton mentagrophytes*, видів *Microsporon*, таких як *Microsporon canis* та *audouinii*. Перелік цих видів грибів не є обмеженням мікотичного спектру, з яким можна боротися, і наданий лише для ілюстрування.

Сполуки формули (I) та фунгіцидна композиція за винаходом можуть бути використані для радикальної або профілактичної боротьби з фітопатогенними грибами рослин або сільськогосподарських культур.

Отже, відповідно до іншого аспекту винаходу забезпечений спосіб радикальної або профілактичної боротьби з фітопатогенними грибами рослин або сільськогосподарських культур, який відрізняється тим, що сполуку формули (I) або фунгіцидну композицію за винаходом наносять на насіння, рослину чи плід рослини або на ґрунт, де росте рослина або де її вирощування є бажаним.

Спосіб обробки за винаходом також може бути придатним для обробки матеріалу для розмноження, такого як клубні та кореневища, але також насіння, сіянців або висаджуваної розсади та рослин або висаджуваних рослин. Цей спосіб обробки також може бути придатним для обробки надземних частин рослини, таких як стовбур, стебло або черешки, листя, квіти та плоди відповідної рослини.

Відповідно до винаходу можна обробляти всі рослини і частини рослин. Під рослинами розуміють всі рослини і популяції рослин, такі як бажані та небажані дикорослі рослини, культивари та сорти рослин (що охороняються або не охороняються правами на сорти рослин або правами агрономів-селекціонерів). Культиварами та сортами рослин можуть бути рослини, одержані звичайними методами розмноження та вирощування, яким можуть допомагати або які можуть бути доповнені одним або більше біотехнологічними методами, такими як застосування подвійних гаплоїдів, злиття протопластів, випадковий та спрямований мутагенез, молекулярні або генетичні маркери, або методами біоінженерії та генної інженерії. Під частинами рослин розуміють всі частини та органи рослин, що розміщені над ґрунтом та під ґрунтом, такі як паростки, листя, цвіт та коріння, до яких відносять, наприклад, листя, голки, стебла, гілки, цвіт, плодоносні тіла, плоди та насіння, а також корені, бульбоцибулини та кореневища. Сільськогосподарські рослини та вегетативний і генеративний розмножувальний матеріал, наприклад, черенки, бульбоцибулини, кореневища, пагони та насіння, також відносяться до частин рослин.

Серед рослин, які можуть бути захищені за допомогою способу відповідно до винаходу, можна зазначити основні польові культури, такі як кукурудза, соя, бавовна, олійне насіння сімейства Brassica, таке як Brassica napus (наприклад, канола), Brassica rapa, B. juncea (наприклад, гірчиця) та Brassica carinata, рис, пшениця, цукровий буряк, цукрова тростина, овес, жито, ячмінь, просо, тритикале, льон, виноградна лоза та різні фрукти та овочі різних ботанічних таксонів, такі як види Rosaceae (наприклад, односім'яні плоди, такі як яблука та груші, але також кісточкові фрукти, такі як абрикоси, вишні, мигдаль і персики, ягідні культури, такі як полуниця), Ribesioideae, Juglandaceae, Betulaceae, Anacardiaceae, Fagaceae, Moraceae, Oleaceae, Actinidaceae, Lauraceae, Musaceae (наприклад, бананові дерева та плантації), Rubiaceae (наприклад, кава), Theaceae, Sterculiaceae, Rutaceae (наприклад, лимони, апельсини та грейпфрут); Solanaceae (наприклад, томати, картопля, перець, баклажани), Liliaceae, Compositae (наприклад, салат-латук, артишок і цикорій, у тому числі корінь цикорію, цикорій-ендивій або звичайний цикорій), Umbelliferae (наприклад, морква, петрушка та селера), Cucurbitaceae (наприклад, огірки – у тому числі корнішони, гарбузи, кавуни, бахчеві культури та дині), Alliaceae (наприклад, цибуля та лук-порей), Cruciferae (наприклад, білокачанна капуста, червона капуста, броколі, цвітна капуста, брюссельська капуста, пекінська капуста, кольрабі, редис, хрін, крес-салат, китайська капуста), Leguminosae (наприклад, арахіс, горох та бобові – такі як квасоля, що в'ється, та кормові боби), Chenopodiaceae (наприклад, буряк кормовий (мангольд), буряк листовий, шпінат, столовий буряк), Malvaceae (наприклад, окра), Asparagaceae (наприклад, аспарагус); садові та лісові культури; декоративні рослини; а також генно-модифіковані гомологи цих культур.

Спосіб обробки за винаходом може бути використаний при обробці генетично модифікованих організмів (ГМО), наприклад, рослин або насіння. Генетично модифікованими рослинами (або трансгенними рослинами) є рослини, до геному яких був стійко інтегрований гетерологічний ген. Вираз "гетерологічний ген" по суті означає ген, який передбачений або складений поза рослиною і при введенні до ядерного, хлоропластного або мітохондріального геному надає трансформованій рослині нових або покращених агрономічних чи інших властивостей шляхом експресії білка або поліпептиду, що становить інтерес, або шляхом даун-регуляції чи сайленсингу іншого гену або генів, присутніх у рослині (із застосуванням, наприклад, антисмислової технології, технології співсупресії або РНК інтерференції – RNAi-технології). Гетерологічний ген, розміщений у геномі, також називають трансгеном. Трансген, визначений своїм особливим розташуванням у геномі рослини, називають трансформаційною

або трансгенною подією.

Залежно від видів або культиварів рослин, їхнього розташування та умов вирощування (ґрунти, клімат, період вегетації, раціон), обробка за винаходом може також спричинити додаткові ефекти. Так, наприклад, можливе зниження норм нанесення та/або розширення спектру активності та/або підвищення активності активних сполук та композицій, які можуть бути використані за винаходом, кращий ріст рослин, підвищена стійкість до високих або низьких температур, підвищена стійкість до посухи або вмісту солі у воді чи ґрунті, підвищена продуктивність цвітіння, полегшення збирання врожаю, прискорене дозрівання, підвищена врожайність, більші плоди, більша висота рослин, більш зелений колір листя, більш раннє цвітіння, вища якість та/або вища поживна цінність зібраних продуктів, більш висока концентрація цукру у плодах, краща стійкість при зберіганні та/або можливість обробки зібраних продуктів, які перевершують звичайно очікувані ефекти.

При певних нормах нанесення комбінації активної сполуки за винаходом можуть також мати зміцнювальний ефект у рослин. Відповідно, вони також є підходящими для мобілізації захисної системи рослини проти нападу небажаних мікроорганізмів. Це може бути, якщо це має місце, однією з причин підвищеної активності комбінацій за винаходом, наприклад, проти грибів. Речовини, що зміцнюють рослини (які індукують стійкість), треба розуміти як такі, що означають, у даному контексті, ті речовини або комбінації речовин, які здатні стимулювати захисну систему рослин таким чином, що при подальшій інокулювання небажаними мікроорганізмами оброблені рослини проявляють істотний ступінь стійкості до цих мікроорганізмів. У даному випадку небажані мікроорганізми треба розуміти як такі, що означають фітопатогенні гриби, бактерії та віруси. Отже, речовини за винаходом можуть бути застосовані для захисту рослин проти нападу згаданих вище патогенів впродовж певного періоду часу після обробки. Період часу, впродовж якого відбувається захист, звичайно триває від 1 до 10 днів, краще від 1 до 7 днів після обробки рослин активними сполуками.

Рослини та культивари рослин, які краще обробляти відповідно до винаходу, включають усі рослини, які мають генетичний матеріал, що надає особливо сприятливих, корисних рис цим рослинам (одержаних вирощуванням та/або біотехнологічними засобами).

Рослини та культивари рослин, які також краще обробляти відповідно до винаходу, є стійкими проти одного або більше біотичного стресу, тобто згадані рослини проявляють кращий захист проти тваринних та мікробних паразитів, таких як нематоди, комахи, кліщі, фітопатогенні гриби, бактерії, віруси та/або віроїди.

Приклади стійких до нематодів рослин описані, наприклад, у патентних заявках США №№ 11/765,491, 11/765,494, 10/926,819, 10/782,020, 12/032,479, 10/783,417, 10/782,096, 11/657,964, 12/192,904, 11/396,808, 12/166,253, 12/166,239, 12/166,124, 12/166,209, 11/762,886, 12/364,335, 11/763,947, 12/252,453, 12/209,354, 12/491,396 або 12/497,221.

Рослинами та культиварами рослин, які також можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, які є стійкими до одного або більше абіотичного стресу. Умови абіотичного стресу можуть включати, наприклад, посуху, зазнання холодної температури, зазнання спеки, осмотичний стрес, затоплення, підвищену солоність ґрунту, підвищений вплив мінералів, вплив озону, вплив яскравого світла, обмежену наявність азотних поживних речовин, обмежену наявність фосфорних поживних речовин, недостатність тіні.

Рослинами та культиварами рослин, які також можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, які відрізняються характеристиками підвищеної врожайності. Підвищена врожайність у таких рослин може бути результатом, наприклад, покращеної фізіології, росту та розвитку рослини, таких як ефективність використання води, ефективність утримання води, покращене використання азоту, покращене поглинання вуглецю, покращений фітосинтез, покращена ефективність пророщування та прискорене дозрівання. На врожайність, крім того, може впливати покращена архітектура рослини (за умов стресу та без стресу), у тому числі, але не обмежуючись цим, раннє цвітіння, контролювання цвітіння для одержання гібридного насіння, міцність сіянців, розмір рослини, кількість та відстань міжвузел, ріст коріння, розмір насіння, розмір плодів, розмір стручків, кількість стручків або качанів, кількість насіння на стручок або качан, маса насіння, підвищене наповнення насіння, знижене розосередження насіння, зниження розтріскування стручків та стійкість до полягання. Інші риси врожаю включають склад насіння, такий як вміст вуглеводню, білка, вміст та склад олії, поживна цінність, зниження антипоживних сполук, покращена здатність до обробляння та краща стійкість при зберіганні.

Невичерпні приклади рослин з наведеними вище ознаками наведені у Таблиці А.

Рослинами, які можна обробляти відповідно до винаходу, є гібридні рослини, які вже проявляють характеристики гетерозу або гібридної сили, результатом яких звичайно є більш висока врожайність, міцність, здоров'я та стійкість до факторів біотичного та абіотичного стресу.

Такі рослини звичайно одержують шляхом схрещування інбредної батьківської лінії з чоловічим безпліддям (батьки жіночої статі) з іншою інбредною лінією з чоловічою плідністю (батьки чоловічої статі). Гібридне насіння звичайно збирають з чоловічих стерильних рослин і продають садоводам-городникам. Іноді чоловічі стерильні рослини можна одержати (наприклад, у кукурудзи) шляхом видалення мітелок або китиць, тобто механічним видаленням чоловічих репродуктивних органів (або чоловічих квіток), але, що є більш типовим, чоловіча стерильність є результатом генетичних детермінантів у геномі рослини. У такому разі, і особливо тоді, коли насіння є бажаним продуктом, врожай якого треба зібрати з гібридних рослин, звичайно є корисним забезпечити, щоб чоловіча плідність гібридних рослин була повністю відновлена. Це може бути здійснене шляхом забезпечення, щоб батьки чоловічої статі мали відповідні гени відновлення плідності, які здатні відновлювати чоловічу плідність в гібридних рослинах, які містять генетичні детермінанти, що відповідають за чоловіче безпліддя. Генетичні детермінанти чоловічої стерильності можуть бути розташовані у цитоплазмі. Приклади цитоплазматичної чоловічої стерильності (CMS), наприклад, були описані у сортів Brassica (WO 92/05251, WO 95/09910, WO 98/27806, WO 05/002324, WO 06/021972 і US 6,229,072). Проте, генетичні детермінанти для чоловічої стерильності також можуть бути розташовані в ядерному геномі. Рослини з чоловічою стерильністю також можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія. Особливо корисний засіб одержання рослин з чоловічою стерильністю описаний у WO 1989/10396, в якому, наприклад, рибонуклеазу, таку як барназа, селективно експресують у клітинах тапетуму в тичинках. Після цього плідність може бути відновлена експресією у клітинах тапетуму інгібітора рибонуклеази, такого як барстар (наприклад, у WO 1991/02069).

Рослини або культивари рослин (одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які можна обробляти відповідно до винаходу, є толерантними до гербіцидів рослинами, тобто рослинами, що є виносливими до одного або більше конкретних гербіцидів. Такі рослини можуть бути одержані або генною трансформацією, або селекцією рослин, що містять мутацію, що надає таку виносливість відносно гербіцидів.

Стійкими до гербіцидів рослинами є, наприклад, гліфосат-толерантні рослини, тобто рослини, яким надана толерантність до гербіцидного гліфосату або його солей. Рослини можна зробити толерантними до гліфосату різними методами. Наприклад, гліфосат-толерантні рослини можна одержати трансформуванням рослини за допомогою гену, що кодує ензим 5-енолпірувілшикімат-3-фосфатсинтази (EPSPS). Прикладами таких генів EPSPS є ген AroA (мутант CT7) бактерії *Salmonella typhimurium* (Comai та ін., 1983, Science 221, 370-371), ген CP4 бактерії виду *Agrobacterium* (Barry та ін., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145), гени, що кодують EPSPS петунії (Shah та ін., 1986, Science 233, 478-481), EPSPS томатів (Gasser та ін., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289), або EPSPS коракану (WO 01/66704). Це також може бути мутований EPSPS, як це описано, наприклад, у EP 0837944, WO 00/066746, WO 00/066747 або WO 02/026995. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати експресією гену, що кодує гліфосатний оксидо-редуктазний ензим, як це описано у патентах США №№ US 5,776,760 та US 5,463,175. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати експресією гену, що кодує гліфосатний ацетилтрансферазний ензим, як це описано, наприклад, у WO 02/036782, WO 03/092360, WO 05/012515 та WO 07/024782. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати селекцією рослин, що містять природні мутації вищезгаданих генів, як описано, наприклад, у WO 01/024615 або WO 03/013226. Рослини, що експресують гени EPSPS, що надають толерантність до гліфосату, описані, наприклад, у патентних заявках США №№ 11/517,991, 10/739,610, 12/139,408, 12/352,532, 11/312,866, 11/315,678, 12/421,292, 11/400,598, 11/651,752, 11/681,285, 11/605,824, 12/468,205, 11/760,570, 11/762,526, 11/769,327, 11/769,255, 11/943801 або 12/362,774. Рослини, що містять інші гени, що надають толерантність до гліфосату, такі як гени декарбоксилази, описані, наприклад, у патентних заявках США №№ 11/588,811, 11/185,342, 12/364,724, 11/185,560 або 12/423,926.

Іншими стійкими до гербіцидів рослинами є, наприклад, рослини, яким надана толерантність до гербіцидів, що інгібують ензимглютамінсинтазу, таких як біалафос, фосфінотрицин або глюфозинат. Такі рослини можна одержати експресією ензиму, що детоксифікує гербіцид, або мутантного глютамінсинтазного ензиму, стійкого до інгібування, наприклад, описаного у патентній заявці США № 11/760,602. Одним із таких ефективних детоксифікувальних ензимів є ензим, що кодує фосфінотрицин ацетилтрансферазу (такий як білок бар або пет виду *Streptomyces*). Рослини, що експресують екзогенну фосфінотрицин ацетилтрансферазу, описані, наприклад, в патентах США №№ 5,561,236; 5,648,477; 5,646,024; 5,273,894; 5,637,489; 5,276,268; 5,739,082; 5,908,810 і 7,112,665.

Іншими гербіцид-толерантними рослинами є також рослини, яким надана толерантність до

гербицидів, що інгібують ензимну гідроксифенілпіруват-діоксигеназу (HPPD). Гідроксифенілпіруватдіоксигенази є ензимами, що каталізують реакцію, в якій пара-гідроксифенілпіруват (HPP) трансформується у гомогентисат. Рослини, толерантні до HPPD-інгібіторів, можуть бути трансформовані за допомогою гену, що кодує природний стійкий HPPD ензим, або гену, що кодує мутований або химерний HPPD ензим, як це описано у міжнародних заявках WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 або патенті США US 6,768,044. Толерантність до HPPD-інгібіторів також може бути досягнута шляхом трансформування рослин за допомогою генів, які кодують певні ензими, що дозволяє утворення гомогентисату, незважаючи на інгібування нативного HPPD ензиму HPPD-інгібітором. Такі рослини та гени описані в міжнародних заявках WO 99/34008 і WO 02/36787. Толерантність рослин до HPPD інгібіторів може бути також покращена трансформуванням рослин за допомогою гену, що кодує ензим, який має активність префенатдегідрогенази (PDH), на додаток до гену, що кодує HPPD-толерантний ензим, як це описано у міжнародній заявці WO 2004/024928. Крім того, рослинам може бути надана більша толерантність до HPPD-інгібіторних гербицидів шляхом додавання до їхнього геному гену, що кодує ензим, здатний до засвоєння або руйнування HPPD-інгібіторів, таких як ензими CYP450, показані в міжнародних заявках WO 2007/103567 і WO 2008/150473.

Ще іншими стійкими до гербицидів рослинами є рослини, яким надана толерантність до інгібіторів ацетолактатсинтази (ALS). Відомі інгібітори ALS включають, наприклад, сульфонілсечовину, імідазолінон, тріазолпіримідини, піримідинілокси(тіо)бензоати та/або сульфоніламінокарбонілтріазолінонові гербициди. Різні мутації в ензимі ALS (також відомої як ацетогідроксикислотна синтаза, AHAS) відомі як такі, що надають толерантність до різних гербицидів і груп гербицидів, як це описано, наприклад, у Tranel і Wright (2002, Weed Science ("Наука про бур'яни") 50:700-712), але також у патентах США №№ 5,605,011, 5,378,824, 5,141,870 і 5,013,659. Одержання толерантних до сульфонілсечовини рослин і толерантних до імідазолінону рослин описано у патентах США №№ 5,605,011; 5,013,659; 5,141,870; 5,767,361; 5,731,180; 5,304,732; 4,761,373; 5,331,107; 5,928,937 і 5,378,824 та в міжнародній заявці WO 96/33270. Інші толерантні до імідазолінону рослини також описані, наприклад, у міжнародних заявках WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351 і WO 2006/060634. Інші толерантні до сульфонілсечовини та імідазолінону рослини також описані, наприклад, у міжнародній заявці WO 07/024782 та патентній заявці США № 61/288958.

Інші рослини, толерантні до імідазолінону та/або сульфонілсечовини, можуть бути одержані індукованим мутагенезом, селекцією в культурах клітин у присутності гербициду або мутаційним вирощуванням, як описано, наприклад, для бобів сої у патенті США 5,084,082, для рису в міжнародній заявці WO 97/41218, для цукрового буряку у патенті США 5,773,702 і міжнародній заявці WO 99/057965, для салата-латука у патенті США 5,198,599 або для соняшника в міжнародній заявці WO 01/065922.

Рослини або культивари рослин (одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є стійкими до комах трансгенними рослинами, тобто рослинами, яким надана стійкість до нападу певних цільових комах. Такі рослини можуть бути одержані генетичною трансформацією або селекцією рослин, що містять мутацію, яка забезпечує таку стійкість до комах.

Використаний у цьому описі вираз "стійка до комах трансгенна рослина" включає будь-яку рослину, що містить принаймні один трансген з кодувальною послідовністю, яка кодує:

1) інсектицидний кристалічний білок *Bacillus thuringiensis* або його інсектицидну частку, такий як інсектицидні кристалічні білки, перелік яких наведено авторами Crickmore та ін. (1998, Microbiology і Molecular Biology Reviews ("Огляди мікробіології та молекулярної біології"), 62: 807-813), видання було оновлене авторами Crickmore та ін. (2005) у номенклатурі токсинів *Bacillus thuringiensis*, адреса он-лайн:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), або його інсектицидні частки, наприклад, білки класів білків Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, або Cry3Bb або їхні інсектицидні частки (наприклад, EP 1999141 і WO 2007/107302), або такі білки, кодовані синтетичними генами, як, наприклад, описані у патентній заявці США № 12/249,016; або

2) кристалічний білок виду *Bacillus thuringiensis* або його частку, що є інсектицидною у присутності другого іншого кристалічного білка виду *Bacillus thuringiensis* або його частки, такого як бінарний токсин, складений з кристалічних білків Cry34 і Cry35 (Moellenbeck та ін. 2001, Nat. Biotechnol. 19: 668-72; Schnepf та ін. 2006, Applied Environm. Microbiol. 71, 1765-1774) або бінарний токсин, складений з білків Cry1A або Cry1F і білків Cry2Aa або Cry2Ab або Cry2Ae

(патентні заявки США № 12/214,022 і EP № 08010791.5); або

3) гібридний інсектицидний білок, що містить частки різних інсектицидних кристалічних білків виду *Bacillus thuringiensis*, такий як гібрид білків 1) вище або гібрид білків 2) вище, наприклад, білок Cry1A.105, продукований подією у кукурудзі MON98034 (WO 2007/027777); або

4) білок будь-якого з 1) по 3) вище, в якому деякі, зокрема з 1 по 10, амінокислоти були заміщені іншою амінокислотою для одержання більш високої інсектицидної активності до цільового виду комах, та/або для розширення діапазону уражених цільових видів комах, та/або внаслідок змін, введених до кодувальної ДНК при клонуванні або трансформуванні, такий як білок Cry3Bb1 у подіях у кукурудзі MON863 або MON88017, або білок Cry3A у події у кукурудзі MIR604; або

5) інсектицидний секретований білок з виду *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus* або його інсектицидна частка, такий як вегетативні інсектицидні білки (VIP), перелік яких наведено на сайті: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, наприклад, білки з класу білків VIP3Aa; або

6) секретований білок з *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, який є інсектицидним у присутності другого секретованого білка з *Bacillus thuringiensis* або *B. cereus*, такий як бінарний токсин, складений з білків VIP1A і VIP2A (WO 1994/21795); або

7) гібридний інсектицидний білок, що містить частки різних секретованих білків з *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, такий як гібрид білків за 1) вище або гібрид білків за 2) вище; або

8) білок будь-якого з 5) по 7) вище, в якому деякі, зокрема з 1 по 10, амінокислоти були замінені іншою амінокислотою для одержання більш високої інсектицидної активності відносно цільового виду комах, та/або для розширення діапазону уражених цільових видів комах, та/або внаслідок змін, внесених до кодувальної ДНК при клонуванні або трансформуванні (при продовженні кодування інсектицидного білка), такий як білок VIP3Aa у події в бавовні COT102; або

9) секретований білок з *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus*, який є інсектицидним у присутності кристалічного білка з *Bacillus thuringiensis*, такий як бінарний токсин, складений з VIP3 і Cry1A або Cry1F (патентні заявки США №№ 61/126083 і 61/195019), або бінарний токсин, складений з білка VIP3 та білків Cry2Aa або Cry2Ab або Cry2Ae (патентні заявки США № 12/214,022 і EP №08010791.5);

10) білок за 9) вище, в якому деякі, особливо з 1 по 10, амінокислоти були заміщені іншою амінокислотою для одержання більш високої інсектицидної активності відносно цільового виду комах, та/або для розширення діапазону уражених цільових видів комах, та/або внаслідок змін, внесених до кодувальної ДНК при клонуванні або трансформуванні (при продовженні кодування інсектицидного білка).

Звичайно до стійких до комах трансгенних рослин, як це використано у цьому описі, також відносяться будь-які рослини, що містять комбінацію генів, що кодують білки будь-якого із вказаних вище з 1 по 10 класів. В одному втіленні, стійка до комах рослина містить понад один трансген, що кодує білок будь-якого із вказаних вище з 1 по 10 класів, для розширення діапазону уражених цільових видів комах при використанні різних білків, спрямованих проти різних цільових видів комах або для затримання розвитку стійкості до комах у рослинах із використанням різних білків, що є інсектицидними для тих самих цільових видів комах, але мають інший механізм дії, такий як зв'язування з різними сайтами зв'язування рецепторів у комасі.

Термін "стійка до комах трансгенна рослина", використаний у цьому описі, також охоплює будь-яку рослину, що містить щонайменше один трансген, який містить послідовність, що продукує після експресії двоспіральну РНК, яка після усмоктування комахою-шкідником рослин інгібує ріст цієї комахи-шкідника, як описано, наприклад, у міжнародних патентних заявках WO 2007/080126, WO 2006/129204, WO 2007/074405, WO 2007/080127 і WO 2007/035650.

Рослини або культивари рослин (одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є толерантними до абіотичних стресів. Такі рослини можна одержати генетичною трансформацією або селекцією рослин, які містять мутацію, що забезпечує таку стійкість до стресу. До особливо придатних рослин, толерантних до стресу, відносяться:

1) рослини, які містять трансген, здатний знижувати експресію та/або активність полі(ADP-рибоза)полімеразного (PARP) гену в клітинах рослини або рослинах, як це описано у заявках WO 00/04173, WO/2006/045633, EP 04077984.5 або EP 06009836.5;

2) рослини, які містять трансген, що підсилює толерантність до стресу, здатний знижувати експресію та/або активність PARC кодувальних генів рослин або клітин рослин, як це описано,

наприклад, у WO 2004/090140;

3) рослини, які містять трансген, що підсилює толерантність до стресу, який кодує рослинно-функціональний ензим шляхом нікотинамідаденін динуклеотидного реутилізаційного (відновлювального) синтезу, у тому числі нікотинамідазу, нікотинат фосфорибозилтрансферазу, моонуклеотид аденілтрансферазу нікотинової кислоти, нікотинамідаденін динуклеотидсинтетазу або нікотинамід фосфорибозилтрансферазу, як це описано, наприклад, у EP 04077624.7, WO 2006/133827, РСТ/EP07/002433, EP 1999263 або WO 2007/107326.

Рослини або культивари рослин (одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, проявляють змінену кількість, якість та/або стабільність зберігання зібраного продукту та/або змінені властивості конкретних інгредієнтів зібраного продукту, наприклад:

1) трансгенні рослини, які синтезують модифікований крохмаль, що за своїми фізико-хімічними характеристиками, зокрема за вмістом амілози або співвідношенням амілоза/амілопектин, ступенем розгалуження, середньою довжиною ланцюга, розподілом бокового ланцюга, поведінкою в'язкості, стійкістю гелеутворення, розміром зернин крохмалю та/або морфологією зернини крохмалю, змінюється порівняно із синтезованим крохмалем у клітинах рослин або рослинах дикого типу, так що він кращим чином підходить для спеціального застосування. Такі трансгенні рослини, що синтезують модифікований крохмаль, розкриті, наприклад, у EP 0571427, WO 95/04826, EP 0719338, WO 96/15248, WO 96/19581, WO 96/27674, WO 97/11188, WO 97/26362, WO 97/32985, WO 97/42328, WO 97/44472, WO 97/45545, WO 98/27212, WO 98/40503, WO99/58688, WO 99/58690, WO 99/58654, WO 00/08184, WO 00/08185, WO 00/08175, WO 00/28052, WO 00/77229, WO 01/12782, WO 01/12826, WO 02/101059, WO 03/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 00/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 02/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 01/14569, WO 02/79410, WO 03/33540, WO 2004/078983, WO 01/19975, WO 95/26407, WO 96/34968, WO 98/20145, WO 99/12950, WO 99/66050, WO 99/53072, US 6,734,341, WO 00/11192, WO 98/22604, WO 98/32326, WO 01/98509, WO 01/98509, WO 2005/002359, US 5,824,790, US 6,013,861, WO 94/04693, WO 94/09144, WO 94/11520, WO 95/35026, WO 97/20936;

2) трансгенні рослини, які синтезують некрохмальні вуглеводневі полімери або некрохмальні вуглеводневі полімери зі зміненими властивостями порівняно з рослинами дикого типу без генної модифікації. Прикладами є рослини, що виробляють поліфруктозу, особливо інулінового та леванового типів, розкриті у EP 0663956, WO 96/01904, WO 96/21023, WO 98/39460, і WO 99/24593, рослини, що виробляють альфа-1,4-глюкани, розкриті у WO 95/31553, US 2002031826, US 6,284,479, US 5,712,107, WO 97/47806, WO 97/47807, WO 97/47808 і WO 00/14249, рослини, що виробляють альфа-1,6 розгалужені альфа-1,4-глюкани, розкриті у WO 00/73422, рослини, що виробляють алтернан, розкриті, наприклад, у WO 00/47727, WO 00/73422, EP 06077301.7, US 5,908,975 та EP 0728213;

3) трансгенні рослини, які виробляють гіалуронан, як, наприклад, ті, що розкриті у WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006304779 та WO 2005/012529;

4) трансгенні рослини або гібридні рослини, такі як цибуля, з характеристиками на зразок "високий вміст розчинних твердих речовин", "низька гострота" (LP) та/або "тривале зберігання" (LS), як описано у патентних заявках США №№ 12/020,360 та 61/054,026.

Рослинами або культиварами рослин (що можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, такі як рослини бавовни, зі зміненими характеристиками волокна. Такі рослини можуть бути одержані генною трансформацією або селекцією рослин, які містять мутацію, що забезпечує такі змінені характеристики волокна, і до них відносяться:

а) рослини, такі як рослини бавовни, які містять змінену форму целюлозасинтазних генів, як ті, що описані у WO 98/00549;

б) рослини, такі як рослини бавовни, які містять змінену форму rsw2 або rsw3 гомологічних нуклеїнових кислот, як ті, що описані у WO 2004/053219;

с) рослини, такі як рослини бавовни, з підвищеною експресією цукрозафосфатсинтази, як ті, що описані у WO 01/17333;

д) рослини, такі як рослини бавовни, з підвищеною експресією цукрозасинтази, як ті, що описані у WO 02/45485;

е) рослини, такі як рослини бавовни, в яких змінена синхронізація плазмодесматального строювання в основі клітини волокна, наприклад шляхом даун-регуляції волоконселективної β-

1,3-глюканази, як ті, що описані у WO 2005/017157, або як ті, що описані у EP 08075514.3 або патентній заявці США №61/128,938;

f) рослини, такі як рослини бавовни, які мають волокна зі зміненою реактивністю, наприклад шляхом експресії N-ацетилглюкозамін-трансферазного гену, у тому числі podC та хітинсинтазних генів, як ті, що описані у WO 2006/136351.

Рослинами або культиварами рослин (що можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, такі як олійний рапс або споріднені рослини сорту Brassica, зі зміненими характеристиками олійного профілю. Такі рослини можна одержати генною трансформацією або селекцією рослин, які містять мутацію, що надає таких змінених характеристик олійного профілю, до яких відносяться:

а) рослини, такі як рослини олійного рапсу, які виробляють олію, що має високий вміст олеїнової кислоти, як ті, що описані, наприклад, у патентах США US 5,969,169, US 5,840,946 або US 6,323,392 або US 6,063,947;

б) рослини, такі як рослини олійного рапсу, які виробляють олію, що має низький вміст лінолевої кислоти, як ті, що описані у патентах США US 6,270,828, US 6,169,190 або US 5,965,755;

с) рослини, такі як рослини олійного рапсу, які виробляють олію, що має низький рівень насичених жирних кислот, як ті, що описані, наприклад, у патенті США No. 5,434,283 або патентній заявці США №12/668303.

Рослинами або культиварами рослин (що можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, такі як олійний рапс або споріднені рослини сорту Brassica, зі зміненими характеристиками обсіпання зерна. Такі рослини можуть бути одержані генною трансформацією або селекцією рослин, які містять мутацію, що надає таких змінених характеристик обсіпання зерна, і до них відносяться рослини, такі як рослини олійного рапсу, із уповільненим або зниженим обсіпанням зерна, як це описано у патентній заявці США № 61/135,230, міжнародних заявках WO09/068313 і WO10/006732.

Особливо придатними трансгенними рослинами, які можна обробляти відповідно до винаходу, є рослини, що містять трансформаційні події або комбінацію трансформаційних подій, що є предметом клопотань для одержання нерегульованого статусу в США до Служби інспекції здоров'я тварин і рослин (APHIS) Міністерства сільського господарства США (USDA), незалежно від того, чи такі клопотання були задоволені або все ще перебувають на розгляді. Ця інформація є завжди доступною у APHIS (4700 Рівер Роуд Рівердейл, штат Меріленд 20737, США), наприклад, на її сайті в Інтернеті (URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html). На дату подання цієї заявки клопотаннями про надання нерегульованого статусу, що перебували на розгляді у APHIS або були задоволені APHIS, були ті, що перелічені в таблиці В, яка містить таку інформацію:

- Клопотання: ідентифікаційний номер клопотання. Технічні описи трансформаційних подій можна знайти в документах окремих клопотань, які можна одержати в APHIS, наприклад, на вебсайті APHIS, із посиланням на номер цього клопотання. Ці описи включені до цієї заявки шляхом посилання.

- Поширення клопотання: посилання на попереднє клопотання, про поширення якого подана заява.

- Організація: найменування юридичної особи, що подає клопотання.

- Об'єкт регулювання: відповідний сорт рослин.

- Трансгенний фенотип: характерна ознака, надана рослинам за допомогою трансформаційної події.

- Трансформаційна подія або лінія: назва події або подій (іноді також позначені як лінія або лінії), щодо якої подано клопотання про надання нерегульованого статусу.

- Документи APHIS: різні документи, опубліковані APHIS відносно клопотання і які можуть бути запитані в APHIS.

Додаткові особливо придатні рослини, що містять одиночні трансформаційні події або комбінації трансформаційних подій, перелічені, наприклад, у базах даних різних національних і регіональних органів управління (див., наприклад, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx і <http://www.agbios.com/dbase.php>).

До інших особливо придатних трансгенних рослин відносяться рослини, які містять трансген у нейтральному або сприятливому в агрономічному відношенні положенні, як це описано у будь-якій з патентних публікацій, наведених у Таблиці С.

Таблиця А

Ознака	Посилання	
Ефективне використання води	WO 2000/073475	
Ефективне використання азоту	WO 1995/009911 WO 1997/030163 WO 2007/092704	WO 2007/076115 WO 2005/103270 WO 2002/002776
Покращений фітосинтез	WO 2008/056915	WO 2004/101751
Стійкість до нематодів	WO 1995/020669 WO 2001/051627 WO 2008/139334 WO 2008/095972 WO 2006/085966	WO 2003/033651 WO 1999/060141 WO 1998/012335 WO 1996/030517 WO 1993/018170
Знижене розтріскування стручків	WO 2006/009649 WO 2004/113542 WO 1999/015680 WO 1999/000502	WO 1997/013865 WO 1996/030529 WO 1994/023043
Стійкість до попелиці	WO 2006/125065 WO 1997/046080	WO 2008/067043 WO 2004/072109
Стійкість до склеротиніозу	WO 2006/135717 WO 2006/055851 WO 2005/090578	WO 2005/000007 WO 2002/099385 WO 2002/061043
Стійкість до ботритису	WO 2006/046861	WO 2002/085105
Стійкість до бремії	US 20070022496 WO 2000/063432	WO 2004/049786
Стійкість до ервінії (микрої гнилі)	WO 2004/049786	
Стійкість до кластеровірусу	WO 2007/073167 WO 2007/053015	WO 2002/022836
Толерантність до стресу (у тому числі посухостійкість)	WO 2010/019838 WO 2009/049110	WO2008/002480 WO2005/033318
Стійкість до тобамовірусу	WO 2006/038794	

Таблиця В

Клопотання щодо надання нерегульованого статусу, задоволені або які перебувають на розгляді в APHIS станом на 31 березня 2010 р.

ПРИМІТКА: Для одержання найбільш актуального переліку сільськогосподарських рослин, які більше не підлягають регулюванню, див. поточний статус клопотань. Цей перелік автоматично поновлюється і відображає всі клопотання, одержані на сьогодні в APHIS, у тому числі клопотання, що перебувають на розгляді, відкликані або задоволені.

Скорочення:

CMV - вірус мозаїки огірка; CPB - колорадський жук; PLRV - вірус скручування листя картоплі; PRSV - вірус кільцевої плямистості папайї; PVY - вірус картоплі Y; WMV2 - вірус 2 мозаїки кавуна; ZYMV - вірус жовтої мозаїки цуккіні.

Клопотання про надання нерегульованого статусу, що перебувають на розгляді

Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
10-070-01p		Virginia Tech	Арахіс	Стійкий до склеротиніозу	N70, P39 та W171
09-349-01p		Dow AgroSciences	Соє	Толерантний до гербіцидів	DAS-68416-4
09-328-01p		Bayer Crop Science	Соє	Толерантний до гербіцидів	FG72
09-233-01p		Dow	Кукурудза	Толерантний до гербіцидів	DAS-40278-9

Клопотання про надання нерегульованого статусу, що перебувають на розгляді					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
09-201-01p		Monsanto	Соя		MON-877Ø5-6
09-183-01p		Monsanto	Соя		MON-87769
09-082-01p		Monsanto	Соя	Стійкий до лускокрилих	MON 87701
09-063-01p		Stine Seed	Кукурудза	Толерантний до гліфосату	HCEM485
09-055-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до посухи	MON 87460
09-015-01p		BASF Plant Science, LLC	Соя	Толерантний до гербіцидів	BPS-CV127-9 Соя
08-366-01p		ArborGen	Евкалипт	Морозостійкий, зі зміненою плодовитістю	ARB-FTE1-08
08-340-01p		Bayer	Бавовна	Толерантний до глюфозинату, стійкий до комах	T304-40XGHB119
08-338-01p		Pioneer	Кукурудза	З чоловічою стерильністю, з відновленою плодовитістю, візуальний маркер	DP-32138-1
08-315-01p		Florigene	Троянда	Зі зміненим кольором квітів	IFD-524Ø1-4 і IFD-529Ø1-9
07-253-01p		Syngenta	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих	MIR-162 Маїс
07-108-01p		Syngenta	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	COT67B
06-354-01p		Pioneer	Соя	З високим вмістом олеїнової кислоти	DP-3Ø5423-1
05-280-01p		Syngenta	Кукурудза	Теплостійка альфа-амілаза	3272
04-110-01p		Monsanto та Forage Genetics	Люцерна	Толерантний до гліфосату	J101, J163
03-104-01p		Monsanto та Scotts	Польовиця біла	Толерантний до гліфосату	ASR368

Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
07-152-01p		Pioneer	Кукурудза	Толерантний до гліфосату та імідазолінону	DP-098140-6
04-337-01p		University of Florida	Папайя	Стійкий до вірусу кільцевої плямистості папайї	X17-2
06-332-01p		Bayer CropScience	Бавовна	Толерантний до гліфосату	GHB614

Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
06-298-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійка до метелика кукурудзяного	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	Соя	Толерантний до гліфосату та ацетолатсинтази	356043 (DP-356Ø43-5)
06-234-01p	98-329-01p	Bayer CropScience	Рис	Толерантний до фосфінотрицину	LLPIC601
06-178-01p		Monsanto	Соя	Толерантний до гліфосату	MON 89788
04-362-01p		Syngenta	Кукурудза	Захищений від злакового кореневого черв'яка	MIR604
04-264-01p		ARS	Сливи	Стійкий до вірусу "віспи" сливи (прихованої мозаїки сливи)	C5
04-229-01p		Monsanto	Кукурудза	Високолізиновий	LY038
04-125-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	88017
04-086-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	MON 88913
03-353-01p		Dow	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	59122
03-323-01p		Monsanto	Цукровий буряк	Толерантний до гліфосату	H7-1
03-181-01p	00-136-01p	Dow	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих і толерантний до фосфінотрицину	TC-6275
03-155-01p		Syngenta	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	COT 102
03-036-01p		Mycogen/Dow	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	281-24-236
03-036-02p		Mycogen/Dow	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	3006-210-23
02-042-01p		Aventis	Бавовна	Толерантний до фосфінотрицину	LLБавовна25
01-324-01p	98-216-01p	Monsanto	Насіння рапсу	Толерантний до гліфосату	RT200
01-206-01p	98-278-01p	Aventis	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину та з контролем запилення	MS1 та RF1/RF2
01-206-02p	97-205-01p	Aventis	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину	Toras 19/2
01-137-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	MON 863
01-121-01p		Vector	Тютюн	Зі зниженим вмістом нікотину	Вектор 21-41
00-342-01p		Monsanto	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	Подія в бавовні 15985

Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
00-136-01p		Mycogen c/o Dow та Pioneer	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих та фосфінотрицину	Лінія 1507
00-011-01p	97-099-01p	Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату	NK603
99-173-01p	97-204-01p	Monsanto	Картопля	Стійкий до PLRV та CPB	RBMT22-82
98-349-01p	95-228-01p	AgrEvo	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину та з чоловічою стерильністю	MS6
98-335-01p		Університет Саскачевану	Льон	Толерантний до залишків гербіциду сульфоніл сечовини в ґрунті	CDC Triffid
98-329-01p		AgrEvo	Рис	Толерантний до фосфінотрицину	LLPIC06, LLPIC62
98-278-01p		AgrEvo	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину і з контролем запилення	MS8 та RF3
98-238-01p		AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	GU262
98-216-01p		Monsanto	Насіння рапсу	Толерантний до гліфосату	RT73
98-173-01p		Novartis Seeds та Monsanto	Буряк	Толерантний до гліфосату	GTSB77
98-014-01p	96-068-01p	AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	A5547-127
97-342-01p		Pioneer	Кукурудза	З чоловічою стерильністю і толерантний до фосфінотрицину	676, 678, 680
97-339-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB та PVY	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-15
97-336-01p		AgrEvo	Буряк	Толерантний до фосфінотрицину	T-120-7
97-287-01p		Monsanto	Томати	Стійкий до лускокрилих	5345
97-265-01p		AgrEvo	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину та Lep.	CBH-351
97-205-01p		AgrEvo	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину	T45
97-204-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB та PLRV	RBMT21-129 та RBMT21-350
97-148-01p		Bejo	Цикорій звичайний	З чоловічою стерильністю	RM3-3, RM3-4, RM3-6
97-099-01p		Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату	GA21

Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
97-013-01p		Calgene	Бавовна	Толерантний до бромксинілу та стійкий до лускокрилих	Події 31807 та 31808
97-008-01p		Du Pont	Соя	Зі зміненням олійним профілем	G94-1, G94-19, G-168
96-317-01p		Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату та стійкий до ECB	MON802
96-291-01p		DeKalb	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненням дозріванням плодів	1 додаткова лінія FLAVRSAVR
96-068-01p		AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	W62, W98, A2704-12, A2704-21, A5547-35
96-051-01p		Cornell U	Папайя	Стійкий до PRSV	55-1, 63-1
96-017-01p	95-093-01p	Monsanto	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	MON809 та MON810
95-352-01p		Asgrow	Гарбуз	Стійкий до CMV, ZYMV, WMV2	CZW-3
95-338-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB	SBT02-5 та -7, ATBT04-6 та -27, -30, -31, -36
95-324-01p		Agritope	Томати	Зі зміненням дозріванням плодів	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	Бавовна	Толерантний до сульфонісечовини	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	Кукурудза	З чоловічою стерильністю	MS3
95-195-01p		Northrup King	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненням дозріванням плодів	2 додаткові лінії FLAVRSAVR
95-145-01p		DeKalb	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину	B16
95-093-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	Томати	Зі зміненням дозріванням плодів	8338
95-045-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненням дозріванням плодів	20 додаткових ліній FLAVRSAVR
94-357-01p		AgrEvo	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину	T14, T25
94-319-01p		Ciba Seeds	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих	Подія 176

Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
94-308-01p		Monsanto	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca та Petoseed	Томати	Зі зниженим рівнем полігалактуронази в плодах	B, Da, F
94-257-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до жорсткокрилих	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23
94-230-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	9 додаткових ліній FLAVRSAVR
94-228-01p		DNA Plant Tech	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	Line N73 1436-111
94-090-01p		Calgene	Насіння рапсу	Зі зміненим олійним профілем	pCGN3828-212/86-18 та 23
93-258-01p		Monsanto	Соя	Толерантний до гліфосату	40-3-2
93-196-01p		Calgene	Бавовна	Толерантний до бромксинілу	BXN
92-204-01p		Upjohn	Гарбуз	Стійкий до WMV2 та ZYMV	ZW-20
92-196-01p		Calgene	Томати	Змінене дозрівання плодів	FLAVR SAVR

*** Поширення клопотання номер: згідно з 7CFR 340.6(e) особа може подати клопотання про те, щоб APHIS поширило визначення нерегульованого статусу на інші організми на підставі їхньої подібності до об'єкта, щодо якого раніше було знято державне регулювання. У цій колонці перелічені раніше задоволені клопотання щодо такого об'єкта, відносно якого раніше було знято державне регулювання.

**** Попереднє ЕО: екологічне оцінювання, яке спочатку є доступним для відкритих зауважень перед його завершенням.

Таблиця С

Вид рослини	Подія	Ознака	Патентний документ
Кукурудза	PV-ZMGT32 (NK603)	Толерантність до гліфосату	US 2007-056056
Кукурудза	MIR604	Стійкість до комах (Cry3a055)	EP 1 737 290
Кукурудза	LY038	Високий вміст лізину	US 7,157,281
Кукурудза	3272	Самообробна кукурудза (альфа-амілаза)	US 2006-230473
Кукурудза	PV-ZMIR13 (MON863)	Стійкість до комах (Cry3Bb)	US 2006-095986
Кукурудза	DAS-59122-7	Стійкість до комах (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139
Кукурудза	TC1507	Стійкість до комах (Cry1F)	US 7,435,807
Кукурудза	MON810	Стійкість до комах (Cry1Ab)	US 2004-180373
Кукурудза	VIP1034	Стійкість до комах	WO 03/052073
Кукурудза	B16	Стійкість до глюфозинату	US 2003-126634
Кукурудза	GA21	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GG25	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GJ11	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	FI117	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GAT-ZM1	Толерантність до гліфосату	WO 01/51654

Таблиця С

Вид рослини	Подія	Ознака	Патентний документ
Кукурудза	MON87460	Посухостійкість	WO 2009/111263
Кукурудза	DP-098140-6	Толерантність до гліфосату / інгібіторів ALS	WO 2008/112019
Пшениця	Подія1	Стійкість до збудника фузаріозу (трихотецен 3-О-ацетилтрансферази)	CA 2561992
Цукровий буряк	T227-1	Толерантність до гліфосату	US 2004-117870
Цукровий буряк	H7-1	Толерантність до гліфосату	WO 2004-074492
Соя	MON89788	Толерантність до гліфосату	US 2006-282915
Соя	A2704-12	Толерантність до гліфосату	WO 2006/108674
Соя	A5547-35	Толерантність до гліфосату	WO 2006/108675
Соя	DP-305423-1	Високий вміст олеїнової кислоти / стійкість до інгібіторів ALS	WO 2008/054747
Рис	GAT-OS2	Толерантність до гліфосату	WO 01/83818
Рис	GAT-OS3	Толерантність до гліфосату	US 2008-289060
Рис	PE-7	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2008/114282
Олійний рапс	MS-B2	Чоловіча стерильність	WO 01/31042
Олійний рапс	MS-BN1/RF-BN1	Чоловіча стерильність/відновлення	WO 01/41558
Олійний рапс	RT73	Стійкість до гліфосату	WO 02/36831
Бавовна	CE43-67B	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128573
Бавовна	CE46-02A	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128572
Бавовна	CE44-69D	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128571
Бавовна	1143-14A	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128569
Бавовна	1143-51B	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128570
Бавовна	T342-142	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128568
Бавовна	Подія 3006-210-23	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2005/103266
Бавовна	PV-GHGT07 (1445)	Толерантність до гліфосату	US 2004-148666
Бавовна	MON88913	Толерантність до гліфосату	WO 2004/072235
Бавовна	EE-GH3	Толерантність до гліфосату	WO 2007/017186
Бавовна	T304-40	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO2008/122406
Бавовна	Cot202	Стійкість до комах (VIP3)	US 2007-067868
Бавовна	LLбавовна25	Стійкість до глюфозинату	WO 2007/017186
Бавовна	EE-GH5	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2008/122406
Бавовна	Подія 281-24-236	Стійкість до комах (Cry1F)	WO 2005/103266
Бавовна	Cot102	Стійкість до комах (Vip3A)	US 2006-130175
Бавовна	MON 15985	Стійкість до комах (Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317
Польовиця	Asr-368	Толерантність до гліфосату	US 2006-162007
Баклажан	EE-1	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2007/091277

Серед хвороб рослин або сільськогосподарських культур, з якими можна боротися за допомогою способу за винаходом, можна зазначити такі:

Хвороби борошнистої роси, такі як:

- 5 Хвороби блюмерії (*Blumeria*), спричинені, наприклад, *Blumeria graminis*;
 Хвороби подосфери (*Podosphaera*), спричинені, наприклад, *Podosphaera leucotricha*;
 Хвороби сфаротеки (*Sphaerotheca*), спричинені, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*;
 Хвороби унцинули (*Uncinula*), спричинені, наприклад, *Uncinula necator*;

Хвороби іржавіння, такі як:

- 10 Хвороби гімноспорангію (*Gymnosporangium*), спричинені, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*;
 Хвороби гемілеї (*Hemileia*), спричинені, наприклад, *Hemileia vastatrix*;
 Хвороби факопсори (*Phakopsora*), спричинені, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomia*;

- Хвороби пущинії (*Puccinia*), спричинені, наприклад, *Puccinia recondite*, *Puccinia graminis* або *Puccinia striiformis*;
- Хвороби уроміцесу (*Uromyces*), спричинені, наприклад, *Uromyces appendiculatus*;
- Хвороби ооміцету (*Oomycete*), такі як:
- 5 Хвороби альбуги (*Albugo*), спричинені, наприклад, *Albugo candida*;
- Хвороби бремії (*Bremia*), спричинені, наприклад, *Bremia lactucae*;
- Хвороби пероноспори (*Peronospora*), спричинені, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;
- Хвороби фітофтори (*Phytophthora*), спричинені, наприклад, *Phytophthora infestans*;
- 10 Хвороби плазмопари (*Plasmopara*), спричинені, наприклад, *Plasmopara viticola*;
- Хвороби псевдопероноспори (*Pseudoperonospora*), спричинені, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;
- Хвороби пітію (*Pythium*), спричинені, наприклад, *Pythium ultimum*;
- Хвороби плямистості листя: плями, прищі, тля, такі як:
- 15 Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, *Alternaria solani*;
- Хвороби церкоспори (*Cercospora*), спричинені, наприклад, *Cercospora beticola*;
- Хвороби кладіоспору (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, *Cladosporium cucumerinum*;
- Хвороби кохліоболусу (*Cochliobolus*), спричинені, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідій: *Drechslera* (*Drechslera*), синонім: *Helminthosporium* (*Helminthosporium*) або *Cochliobolus miyabeanus*;
- 20 Хвороби колетотрихуму (*Colletotrichum*), спричинені, наприклад, *Colletotrichum lindemuthianum*;
- Хвороби циклоконію (*Cycloconium*), спричинені, наприклад, *Cycloconium oleaginum*;
- Хвороби діапорте (*Diaporthe*), спричинені, наприклад, *Diaporthe citri*;
- 25 Хвороби ельсине (*Elsinoe*), спричинені, наприклад, *Elsinoe fawcettii*;
- Хвороби глеоспорію (*Gloeosporium*), спричинені, наприклад, *Gloeosporium laeticolor*;
- Хвороби гломерели (*Glomerella*), спричинені, наприклад, *Glomerella cingulata*;
- Хвороби гігнاردії (*Guignardia*), спричинені, наприклад, *Guignardia bidwelli*;
- Хвороби лептосферії (*Leptosphaeria*), спричинені, наприклад, *Leptosphaeria maculans*;
- 30 *Leptosphaeria nodorum*;
- Хвороби магнапорте (*Magnaporthe*), спричинені, наприклад, *Magnaporthe grisea*;
- Хвороби мікосфарели (*Mycosphaerella*), спричинені, наприклад, *Mycosphaerella graminicola*;
- Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- Хвороби фасфарії (*Phaeosphaeria*), спричинені, наприклад, *Phaeosphaeria nodorum*;
- 35 Хвороби піренофори (*Pyrenophora*), спричинені, наприклад, *Pyrenophora teres* або *Pyrenophora tritici repentis*;
- Хвороби рамуларії (*Ramularia*), спричинені, наприклад, *Ramularia collo-cygni* або *Ramularia areola*;
- Хвороби ринхоспорію (*Rhynchosporium*), спричинені, наприклад, *Rhynchosporium secalis*;
- 40 Хвороби септорії (*Septoria*), спричинені, наприклад, *Septoria apii* або *Septoria lycopersici*;
- Хвороби тифули (*Typhula*), спричинені, наприклад, *Typhula incarnata*;
- Хвороби вентурії (*Venturia*), спричинені, наприклад, *Venturia inaequalis*; Хвороби коріння та стебла, такі як:
- Хвороби кортицію (*Corticium*), спричинені, наприклад, *Corticium graminarum*;
- 45 Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium oxysporum*;
- Хвороби геуманоміцію (*Gaeumannomyces*), спричинені, наприклад, *Gaeumannomyces graminis*;
- Хвороби ризоктонії (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;
- Хвороби сарокладію (*Sarocladium*), спричинені, наприклад, *Sarocladium oryzae*;
- 50 Хвороби склеротію (*Sclerotium*), спричинені, наприклад, *Sclerotium oryzae*;
- Хвороби тапесії (*Tapesia*), спричинені, наприклад, *Tapesia acuformis*;
- Хвороби тилавіопсису (*Thielaviopsis*), спричинені, наприклад, *Thielaviopsis basicola*;
- Хвороби колосся та суцвіття у вигляді мітли, такі як:
- Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, видом *Alternaria*;
- 55 Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
- Хвороби кладоспорію (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, видом *Cladosporium*;
- Хвороби клавісепсу (*Claviceps*), спричинені, наприклад, *Claviceps purpurea*;
- Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;
- Хвороби гіберели (*Gibberella*), спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;
- 60 Хвороби монографели (*Monographella*), спричинені, наприклад, *Monographella nivalis*;

- Хвороби головні та мокрої голови, такі як:
 Хвороби сфацелотеки (*Sphacelotheca*), спричинені, наприклад, *Sphacelotheca reiliana*;
 Хвороби тилетії (*Tilletia*), спричинені, наприклад, *Tilletia caries*;
 Хвороби уроцистису (*Urocystis*), спричинені, наприклад, *Urocystis occulta*;
 5 Хвороби устилаго (*Ustilago*), спричинені, наприклад, *Ustilago nuda*;
 Хвороби гниття та плісняви фруктів, такі як:
 Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
 Хвороби ботритису (*Botrytis*), спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*;
 Хвороби пеніцилію (*Penicillium*), спричинені, наприклад, *Penicillium expansum*;
 10 Хвороби ризофусу (*Rhizopus*), спричинені, наприклад, *Rhizopus stolonifer*;
 Хвороби склеротинії (*Sclerotinia*), спричинені, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*;
 Хвороби вертицилію (*Verticillium*), спричинені, наприклад, *Verticillium albo-atrum*;
 Хвороби гниття, плісняви, зів'янення, гнилизни і випрівання (чорної ніжки) насіння та ґрунту, такі як:
 15 Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, *Alternaria brassicicola*;
 Хвороби афаноміцесу (*Aphanomyces*), спричинені, наприклад, *Aphanomyces euteiches*;
 Хвороби аскохита (*Ascochyta*), спричинені, наприклад, *Ascochyta lentis*;
 Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
 Хвороби кладоспорію (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, *Cladosporium herbarum*;
 20 Хвороби кохліоболусу (*Cochliobolus*), спричинені, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідій: *Drechslera*, *Bipolaris*, синонім: *Helminthosporium*);
 Хвороби колетотрихуму (*Colletotrichum*), спричинені, наприклад, *Colletotrichum coccodes*;
 Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;
 Хвороби гіберели (*Gibberella*), спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;
 25 Хвороби макрофоміни (*Macrophomina*), спричинені, наприклад *Macrophomina phaseolina*;
 Хвороби монографели (*Monographella*), спричинені, наприклад *Monographella nivalis*;
 Хвороби пеніцилію (*Penicillium*), спричинені, наприклад, *Penicillium expansum*;
 Хвороби фома (*Phoma*), спричинені, наприклад, *Phoma lingam*;
 Хвороби фомопсису (*Phomopsis*), спричинені, наприклад, *Phomopsis sojae*;
 30 Хвороби фітофтори (*Phytophthora*), спричинені, наприклад, *Phytophthora cactorum*;
 Хвороби піренофори (*Pyrenophora*), спричинені, наприклад, *Pyrenophora graminis*;
 Хвороби пірикулярію (*Pyricularia*), спричинені, наприклад, *Pyricularia oryzae*;
 Хвороби пітію (*Pythium*), спричинені, наприклад, *Pythium ultimum*;
 Хвороби ризоктонії (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;
 35 Хвороби ризопусу (*Rhizopus*), спричинені, наприклад *Rhizopus oryzae*;
 Хвороби склеротію (*Sclerotium*), спричинені, наприклад, *Sclerotium rolfsii*;
 Хвороби септорії (*Septoria*), спричинені, наприклад, *Septoria nodorum*;
 Хвороби тифули (*Typhula*), спричинені, наприклад, *Typhula incarnata*;
 Хвороби вертицилію (*Verticillium*), спричинені, наприклад, *Verticillium dahliae*;
 40 Хвороби у вигляді червоточини, засихання вершин та мітел, такі як:
 Хвороби нектрії (*Nectria*), спричинені, наприклад, *Nectria galligena*;
 Хвороби, які характеризуються зів'яненням, гниттям або припиненням росту, такі як:
 Хвороби монілінії (*Monilinia*), спричинені, наприклад, *Monilinia laxa*;
 Хвороби пухирчастості або закручування листя, такі як:
 45 Хвороби екзобазидію (*Exobasidium*), спричинені, наприклад, *Exobasidium vexans*;
 Хвороби тафрини (*Taphrina*), спричинені, наприклад, *Taphrina deformans*;
 Хвороби погіршення стану дерев'янистих рослин, такі як:
 Хвороби еска (*Esca*), спричинені, наприклад, *Phaemoniella clamydosporea*;
 Хвороби еутипа дайбек (*Eutypa dyebekii*), спричинені, наприклад, *Eutypa lata*;
 50 Хвороби ганодерма (*Ganoderma*), спричинені, наприклад, *Ganoderma boninense*;
 Хвороби ригідопорусу (*Rigidoporus*), спричинені, наприклад, *Rigidoporus lignosus*;
 Хвороби квітів і насіння, такі як:
 Хвороби ботритису (*Botrytis*), спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*;
 Хвороби бульби, такі як:
 55 Хвороби ризоктонію (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;
 Хвороби гельмінтоспорію (*Helminthosporium*), спричинені, наприклад, *Helminthosporium solani*;
 Хвороби кіли хрестоцвітних, такі як:
 Хвороби плазмодіофори (*Plasmodiophora*), спричинені, наприклад, *Plasmodiophora brassicae*;
 60 Хвороби, спричинені бактерійними організмами, такими як:

Вид ксантоманас (*Xanthomonas*), наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
 Вид псевдомонас (*Pseudomonas*), наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
 Вид ервінія (*Erwinia*), наприклад, *Erwinia amylovora*.

Композиція за винаходом може також бути використана проти грибкових хвороб, схильних до розростання на або всередині деревини. Термін "деревина" означає усі типи сортів дерева та усі типи обробки цього дерева, призначеної для будівництва, наприклад, тверде дерево, дерево з високою щільністю, ламіноване дерево та клеєна фанера. Спосіб обробки деревини відповідно до винаходу здебільшого полягає у контактуванні з однією або більше сполуками за винаходом або композицією за винаходом; до цього відноситься, наприклад, безпосереднє нанесення, обприскування, занурювання, упорскування або будь-які інші підходящі способи.

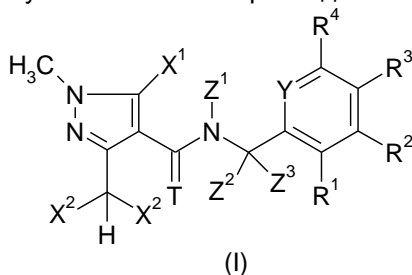
Доза активної сполуки, яку звичайно наносять способом обробки відповідно до винаходу, звичайно і переважно становить від 10 до 800 г/га, краще від 50 до 300 г/га для нанесення при обробці листя. Доза нанесеної активної речовини звичайно і переважно становить від 2 до 200 г на 100 кг насіння, краще від 3 до 150 г на 100 кг насіння у разі обробки насіння.

Є чітко зрозумілим, що зазначені тут дози подані як ілюстративні приклади способу відповідно до винаходу. Спеціаліст у цій галузі знатиме, як адаптувати дози нанесення, особливо відповідно до природи рослини або сільськогосподарської культури, що підлягає обробці.

Сполуки або суміші відповідно до винаходу також можуть бути використані для одержання композиції, придатної для радикального або профілактичного лікування грибкових хвороб людини або тварини, таких, як, наприклад, мікози, дерматози, захворювання стригучого лишая та кандидамікози, або захворювання, спричинені видом *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus fumigatus*.

Тепер різноманітні аспекти винаходу будуть проілюстровані із посиланням на наведену далі таблицю прикладів сполук та приклади одержання або ефективності.

Таблиця 1 ілюструє не обмежувальним чином приклади сполук формули (I) за винаходом.



У таблиці 1, якщо не вказано інакше, $M+H$ ($Apcl^+$) означає пік молекулярних іонів плюс 1 ч.а.м. (частка атомної маси), як це спостерігали під час масової спектроскопії шляхом хімічної іонізації позитивного атмосферного тиску.

У таблиці 1 значення $\log P$ визначали відповідно до директиви ЄЕС 79/831, Додаток V.A8, шляхом ВЕРХ (високоефективної рідинної хроматографії) на колонці зі зворотною фазою (C 18) із використанням описаного нижче способу:

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

Калібрування проводили із використанням нерозгалужених алкан-2-онів (із вмістом від 3 до 16 атомів вуглецю) з відомими значеннями $\log P$ (визначення значень $\log P$ часом утримування із використанням лінійної інтерполяції між двома послідовними алканонами). Максимальні значення λ_{max} визначали із використанням УФ-спектру від 200 нм до 400 нм та пікових значень хроматографічних сигналів.

Таблиця 1

Сполука	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	logP	Маса M+H
1	Cl	F	O	H	Me	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,49	314
2	F	F	O	H	Me	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,33	298
3	F	F	O	H	CN	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,07	
4	Cl	F	O	H	CN	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,20	
5	Cl	F	O	Me	H	H	Me	H	H	H	CR ⁵	Me	3,02	342
6	F	F	O	Me	H	H	Me	H	H	H	CR ⁵	Me	2,84	326
7	Cl	F	O	H	CN	H	F	H	H	F	CR ⁵	H	2,31	
8	F	F	O	H	CN	H	F	H	H	F	CR ⁵	H	2,01	
9	F	F	O	H	Me	Me	F	H	H	H	CR ⁵	F	4,19	348
10	Cl	F	O	H	Me	Me	F	H	H	H	CR ⁵	F	3,89	364
11	F	F	O	ціанометил	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	2,68	351
12	F	F	O	циклобутил	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,63	366
13	F	F	O	Et	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,13	340
14	F	F	O	i-Pr ⁽¹⁾	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,39	354
15	F	F	O	Me	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	2,81	326
16	F	F	O	аліл	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,36	352
17	F	F	O	пропаргіл	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,10	350
18	F	F	S	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,44	362
19	Cl	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,33	402
20	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,92	348
21	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,69	334
22	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,15	362
23	F	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,21	386
24	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,75	332
25	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,50	318
26	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,92	346
27	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,84	362
28	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,68	346
29	F	F	O	H	Me	H	Cl	Cl	H	H	CR ⁵	H	3,13	366
30	Cl	F	O	циклобутил	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	422
31	F	F	O	циклобутил	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	406
32	Cl	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	436
33	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	382
34	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	368
35	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	396
36	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	366
37	F	F	O	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	352
38	F	F	O	H	- CH ₂ CH ₂ -	Cl		H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	378
39	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	380
40	F	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	420
41	Cl	F	O	H	- CH ₂ CH ₂ -	Cl		H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	394
42	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,37	382
43	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,19	366
44	Cl	F	S	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,99	398
45	F	F	O	OMe	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,65	396
46	Cl	F	O	OMe	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,81	412
47	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	368

Таблиця 1

Сполука	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	logP	Маса M+H
48	Cl	F	O	H	- CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	394
49	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,89	396
50	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	382
51	F	F	O	H	- CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	378
52	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,89	380
53	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	366
54	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	352
55	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,33	396
56	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,15	380
57	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,23	382
58	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,02	366
59	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,89	368
60	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	4,39	352
61	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,02	382
62	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,82	366
63	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,25	396
64	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,13	380
65	F	F	O	H	H	H	c-Pr ⁽¹⁾	H	H	H	CR ⁵	H	2,78	324
66	Cl	F	O	H	H	H	c-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	2,98	340
67	F	F	O	ціанометил	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	2,94	365
68	F	F	O	Et	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,42	354
69	F	F	O	i-Pr	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,70	368
70	F	F	O	циклобутил	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,90	380
71	F	F	O	аліл	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,66	366
72	F	F	O	Me	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	340
73	F	F	O	пропаргіл	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,37	364
74	F	F	O	H	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,02	326
75	F	F	S	циклобутил	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	4,63	396
76	F	F	O	OMe	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,37	356
77	Cl	F	O	OMe	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,51	372
78	F	F	O	2,2- дифторетил	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,49	
79	Cl	F	O	H	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,19	342
80	F	F	O	2,2- дифторетил	H	H	i-Pr	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,81	
81	F	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,76	352
82	Cl	F	O	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	382
83	Cl	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,96	368
84	F	F	O	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,96	366
85	Cl	F	S	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,55	398
86	Cl	F	O	3-тіетаніл	H	H	CF ₃	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,08	474
87	F	F	O	3-тіетаніл	H	H	CF ₃	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,92	458
88	F	F	O	ціанометил	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,68	425
89	F	F	O	Me	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,93	400
90	F	F	O	циклобутил	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,81	440
91	F	F	O	Et	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,22	414
92	F	F	O	i-Pr	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,61	428
93	F	F	O	пропаргіл	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,05	424
94	F	F	O	аліл	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,37	426

Таблиця 1

Сполука	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	logP	Маса M+H
95	F	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	F	2,69	370
96	Cl	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	F	2,86	386
97	F	F	O	ціанометил	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	3,52	395
98	F	F	O	циклобутил	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	4,61	410
99	F	F	O	Et	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	4,09	384
100	F	F	O	аліл	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	4,27	396
101	F	F	O	пропаргіл	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	3,93	394
102	F	F	O	i-Pr	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	4,37	398
103	F	F	O	Me	H	H	Триметил- силіл	H	H	H	CR ⁵	H	3,78	370
104	Cl	F	O	Me	H	H	Br	H	H	H	CR ⁵	H	2,90	392
105	F	F	O	Me	H	H	Br	H	H	H	CR ⁵	H	2,71	376
106	Cl	F	O	H	H	H	SCF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,29	400
107	F	F	O	H	H	H	SCF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	384
108	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	CF ₃	H	H	CR ⁵	H	3,65	406
109	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	CF ₃	H	H	CR ⁵	H	3,80	422
110	F	F	O	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	CR ⁵	H	3,25	338
111	Cl	F	O	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	CR ⁵	H	3,44	354
112	Cl	F	O	H	Me	Me	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,73	396
113	Cl	F	O	H	H	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,23	368
114	F	F	O	H	Me	Me	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,59	380
115	F	F	O	H	H	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,09	352
116	Cl	F	O	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,65	396
117	F	F	O	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,46	380
118	F	F	S	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	4,24	396
119	F	F	O	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CR ⁵	H	1,79	344
120	Cl	F	O	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CR ⁵	H	1,36	360
121	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	3,72	406
122	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	3,87	422
123	F	F	O	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	2,75	352
124	Cl	F	O	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	2,90	368
125	F	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	Cl	CF ₃	CR ⁵	H	3,27	412
126	Cl	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	Cl	CF ₃	CR ⁵	H	3,41	428
127	F	F	O	H	H	H	H	H	Cl	H	CR ⁵	H	2,55	318
128	Cl	F	O	H	H	H	H	H	Cl	H	CR ⁵	H	2,70	334
129	F	F	O	H	Me	H	H	H	цикло- гексил	H	CR ⁵	H	4,34	380
130	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OEt	H	CR ⁵	H	3,59	398
131	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OEt	H	CR ⁵	H	3,44	382
132	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OMe	H	CR ⁵	H	3,19	384
133	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OMe	H	CR ⁵	H	3,06	368
134	F	F	O	H	H	H	H	H	OMe	H	CR ⁵	H	2,08	314
135	F	F	O	H	H	H	H	H	t-Bu ⁽¹⁾	H	CR ⁵	H	3,42	340
136	Cl	F	O	H	H	H	H	H	t-Bu	H	CR ⁵	H	3,58	356

Таблиця 1

Сполука	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	logP	Ма- са M+H
137	Cl	F	O	H	H		-CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	2.73	326
138	F	F	O	H	H		-CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	2.57	310
139	Cl	F	O	H	H		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	3.02	340
140	F	F	O	H	H		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	2.84	324
141	F	F	O	Me	H		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	2.92	338
142	Cl	F	O	Me	H		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	H	CR ⁵	H	3.09	354
143	Cl	F	O	H	H	H	фенокси	H	H	H	CR ⁵	H	3.46	392
144	F	F	O	H	H	H	фенокси	H	H	H	CR ⁵	H	3.25	376
145	F	F	O	H	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.23	376
146	Cl	F	O	H	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.46	392
147	Cl	F	O	3-оксетаніл	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.19	448
148	F	F	O	3-оксетаніл	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.06	432
149	Cl	F	O	Me	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.46	406
150	F	F	O	Me	H	H		фенокси	H	H	CR ⁵	H	3.31	390
151	Cl	F	O	H	H	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.37	392
152	F	F	O	H	H	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.23	376
153	Cl	F	O	Me	Me	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.76	420
154	F	F	O	Me	Me	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.59	404
155	Cl	F	O	Me	H	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.48	406
156	F	F	O	Me	H	H		H	фенокси	H	CR ⁵	H	3.33	390
157	Cl	F	O	Me	H	H		H	4-хлор фенокси	H	CR ⁵	H	3.96	440
158	F	F	O	Me	H	H		H	4-хлор фенокси	H	CR ⁵	H	3.81	424
159	Cl	F	O	H	Me	H		H	Бензил- окси	H	CR ⁵	H	3.58	420
160	Cl	F	O	H	H	H		H	Бензил- окси	H	CR ⁵	H	3.37	406
161	F	F	O	H	H	H		H	Бензил- окси	H	CR ⁵	H	3.23	390
162	F	F	O	H	Me	H		H	Бензил- окси	H	CR ⁵	H	3.41	404
163	F	F	O	H	H	H	феніл	H	H	H	CR ⁵	H	3.21	360
164	Cl	F	O	H	H	H	феніл	H	H	H	CR ⁵	H	3.39	376
165	Cl	F	O	H	H	H		феніл	H	H	CR ⁵	H	3.33	376
166	F	F	O	H	H	H		феніл	H	H	CR ⁵	H	3.19	360
167	Cl	F	O	H	Me	H		H	феніл	H	CR ⁵	H	3.62	390
168	Cl	F	O	H	H	H		H	феніл	H	CR ⁵	H	3.35	376
169	F	F	O	H	Me	H		H	феніл	H	CR ⁵	H	3.46	374
170	F	F	O	H	H	H		H	феніл	H	CR ⁵	H	3.21	360
171	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -	H		H	H	H	N	-	1.30	355
172	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -	H		H	H	H	N	-	1.13	339
173	Cl	F	O	Me	H	H		Cl	H	H	N	-	2.01	349
174	F	F	O	Me	H	H		Cl	H	H	N	-	1.84	333
175	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3.19	401
176	F	F	O	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	2.76	387
177	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3.48	417
178	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3.08	403
179	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2.53	367
180	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2.73	383
181	F	F	O	OMe	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2.73	383

Таблиця 1

Сполука	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	logP	Ма- са M+H
182	Cl	F	O	OMe	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,88	399
183	F	F	O	циклопен- тил	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	3,85	421
184	Cl	F	O	циклопен- тил	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,11	437
185	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,92	381
186	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	3,11	397
187	F	F	O	циклопен- тил	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,44	435
188	Cl	F	O	циклопен- тил	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,67	451
189	Cl	F	O	циклопен- тил	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	4,21	471
190	F	F	O	циклопен- тил	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3,96	455
191	Cl	F	O	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,79	396
192	F	F	O	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,61	380

Примітка 1: i-Pr: ізопропіл; c-Pr: циклопропіл; t-Bu: тертіобутил

Наведені далі приклади ілюструють необмежувальним чином одержання та ефективність сполук формули (I) відповідно до винаходу.

Синтез 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (приклад IIIa-1)

- 5 У колбу об'ємом 500 мл додали 6,0 г (31 ммоль) 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбальдегіду до 30 мл толуолу. До реакційної суміші додали розчин 2,4 г (62 ммоль) гідроксиду натрію у 6 мл води, а потім 103 мл 30 %-ного розчину пероксиду водню у воді при підтриманні температури нижче 37 °C. Після завершення додавання реакційну суміш збовтували при температурі 50 °C впродовж 7 годин. Після повернення реакційної суміші до кімнатної температури дві фази відокремили, і органічну фазу екстрагували 100 мл води. Поєднані водні фази окислили до рівня pH 2 водною соляною кислотою. Одержаний білий осад відфільтрували, двічі промили 20 мл води та висушили для одержання 3,2 г 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти у вигляді білої твердої речовини. ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ ч./млн: 3,78 (s, 3H); 7,12 (t, 1H, J_{HF}=53,60 Гц); 13,19 (s, 1H); IR (KBr): 1688 см⁻¹ (C=O); 2200-3200 см⁻¹ шир. (водневий зв'язок).

Синтез 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду (приклад IIIb-1)

- 20 3,2 г 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти та 44,3 мл тіонілхлориду нагрівали зі зворотним холодильником впродовж 5 годин. Після охолодження реакційну суміш випарили у вакуумі для одержання 3,5 г 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду у вигляді жовтої олії. ¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃-d₆) δ ч./млн: 3,97 (s, 3H); 7,00 (t, J=52,01 Гц, 1H); IR (TQ): 1759 і 1725 см⁻¹ (C=O).

Синтез 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонілфториду (приклад IIIc-1)

- 25 До висушеного розчину 4,0 г (70 ммоль) фториду калію у 21 мл тетрагідротіофен-1,1-діоксиду додали розчин 5,0 г (22 ммоль) 5-хлор-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду в 15 мл толуолу при температурі 100 °C. Одержану реакційну суміш збовтували при температурі 190-200 °C впродовж 22 годин. Дистильовання у вакуумі дало 8 г розчину (0,25 M) 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонілфториду у тетрагідротіофен-1,1-діоксиді. ¹H ЯМР (250 МГц, CHCl₃-d₆) δ ч./млн: 3,87 (s, 3H); 6,79 (t, J=53,75 Гц, 1H); ¹⁹F ЯМР (250 МГц, CHCl₃-d₆) δ ч./млн: 45,37 (s, COF); -117,5 (d, J=28,2 Гц); -131,6 (m).

30 Синтез 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (приклад IIIId-1)

До 400 мл 1N водного розчину гідроксиду натрію додали краплями 67,5 г розчину (0,1 M) 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонілфториду у тетрагідротіофен-1,1-діоксиді. Температуру підтримували нижче 20 °C під час додавання. Через 2 години збовтування при

кімнатній температурі реакційну суміш обережно окислили до рівня pH 2 концентрованою водною соляною кислотою. Одержаний білий осад відфільтрували, промили водою та висушили для одержання 6 г 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти у вигляді білої твердої речовини. ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d_6) δ ч./млн: 3,90 (s, 3H); 7,22 (t, 1H, $J_{\text{HF}}=53,55$ Гц); 13,33 (s, 1H).

Синтез 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбоніл хлориду (приклад IIIe-1)

9,1 г 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти та 75,5 мл тіонілхлориду нагрівали зі зворотним холодильником впродовж 1,5 годин. Після охолодження реакційну суміш випарили у вакуумі для одержання 10 г 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду у вигляді жовтої олії. ГС-МС; спостережений м/з: молекулярний іон: (M^+) = 212; фрагменти: ($\text{M}^+ - \text{Cl}$) = 177 та ($\text{M}^+ - \text{F}$) = 193.

Загальний приклад одержання 2: одержання амідну формули (I) на приладі Chemspeed™

У пробірку Chemspeed™ об'ємом 13 мл ввели 4 мл 0,15 М розчину аміну (II) (0,60 ммоль) у дихлорметані, а потім 0,72 ммоль тріетиламіну. На швидкості 1 мл/хв. додали 2 мл 0,30 М розчину ацилхлориду (IIIb) або (IIIe) (0,60 ммоль), і потім суміш збовтували при кімнатній температурі впродовж ночі. Потім додали 1 мл води, і суміш вилили на патрон лужного оксиду алюмінію (2 г) та елюювали дихлорметаном. Розчинники видалили, і сиру амідну похідну аналізували мас-спектроскопією рідинної хроматографії (MCPX) та ЯМР. Недостатньо чисті сполуки додатково очистили препаративною MCPX.

Загальний приклад одержання 3: тіонування амідну формули (I) на приладі Chemspeed™

У пробірку Chemspeed об'ємом 13 мл відважили 0,27 ммоль фосфорного пентасульфід (P_2S_5). Додали 3 мл 0,18 молярного розчину амідну (I) (0,54 ммоль) в діоксані, і суміш нагрівали зі зворотним холодильником впродовж двох годин. Потім температуру охолодили до 80 °C, і додали 2,5 мл води. Суміш нагрівали до 80 °C ще одну годину. Потім додали 2 мл води, і реакційну суміш двічі екстрагували 4 мл дихлорметану. Органічну фазу відклали на патрон лужного оксиду алюмінію (2 г) і двічі елюювали 8 мл дихлорметану. Розчинники видалили, і сиру тіоамідну похідну аналізували мас-спектроскопією рідинної хроматографії (MCPX) та ЯМР. Недостатньо чисті сполуки додатково очистили препаративною MCPX.

Приклад А: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Sphaerotheca fuliginea* (орірки)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилформамід

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Через день після цієї обробки рослини інокулювали водною суспензією спор *Sphaerotheca fuliginea*. Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 23 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 70 %.

Випробування оцінювали через 7 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 75 %) до повного (100 % боротьби з хворобою) захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці А:

Таблиця А:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
12	95	45	100	90	100
13	90	49	94	91	95
15	83	50	98	98	96
17	94	52	80	99	95
18	90	53	95	103	91
19	84	55	83	108	85
20	94	56	95	112	95
22	80	65	85	116	75
24	89	68	100	117	95
26	88	70	100	118	95
28	85	71	91	125	100
29	93	72	98	162	88
32	95	73	98	169	89
33	96	74	95	175	95
35	86	75	100	177	93
36	93	76	93	191	100
38	89	78	93	192	100
39	95	82	94		
40	83	84	90		

За таких самих умов спостерігали високий (щонайменше 90 %) захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 29, тоді як середній (менше ніж 60 %) захист спостерігали зі сполукою з прикладу 1.043, розкритого в патентній заявці WO-2009/024342, як показано в таблиці B2.

Таблиця A2:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
29 з цього винаходу	500	93
1.043 з WO2009/024342	500	55

Приклад 1.043, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2009/024342, відповідає N-[1-(2,3-дихлорфеніл)етил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/024342.

Приклад В: Профілактичне випробування в умовах *in vivo* на *Alternaria solani* (томати)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилформаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольефіру

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Через день після цієї обробки рослини інокулювали водною суспензією спор *Alternaria solani*. Рослини залишалися впродовж одного дня в інкубаторному ящику при температурі приблизно 22 °C та відносній атмосферній вологості 100 %. Потім рослини поклали в інкубаторний ящик при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості 96 %.

Випробування оцінювали через 7 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 70 %) до повного (100 % боротьби з хворобою) захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці В:

Таблиця В:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
1	95	56	100	121	70
2	93	65	90	127	90
12	90	68	80	129	95
13	95	70	90	137	89
15	95	71	95	138	94
16	80	72	95	139	100
17	80	73	95	140	94
18	95	74	95	141	80
19	90	76	94	144	89
20	95	78	100	145	90
23	89	81	90	147	70
24	94	82	100	148	80
26	94	83	90	150	70
27	80	84	100	152	89
28	95	85	95	153	90
29	94	88	80	154	95
30	90	89	95	156	89
33	95	90	95	158	95
36	94	91	100	161	94
37	94	98	70	162	100
38	94	99	95	166	78
39	70	100	80	167	95
40	94	101	70	169	94
41	80	103	90	170	94
43	90	105	95	175	95
44	100	107	80	176	70
45	100	110	94	177	90
46	100	112	80	179	90
50	95	113	90	180	80
51	94	115	94	181	80
53	94	116	95	185	100
54	89	117	100	191	95
55	95	118	100	192	95

5 За таких самих умов спостерігали від відмінного (щонайменше 95 %) до високого (щонайменше 90 %) захисту при дозі 500 ч./млн. і 100 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 129, тоді як від доброго захисту (щонайменше 80 %) до відсутності захисту спостерігали зі сполукою з прикладу 1.029, розкритого в патентній заявці WO-2009/024342, як показано в таблиці В2.

10 Таблиця В2:

Приклад	доза (ч./млн)	ефективність
129 з цього винаходу	500	95
	100	90
1.029 з WO2009/024342	500	89
	100	0

15 Приклад 1.029, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2009/024342, відповідає N-[1-(4-циклогексилфеніл)етил]-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксаміду.
Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж

структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/024342.

За таких самих умов спостерігали від високого (щонайменше 90 %) до відмінного (щонайменше 95 %) захисту при дозі 500 ч./млн. активного інгредієнта зі сполукою 30 без будь-якого пошкодження рослин, тоді як 100 % пошкодження рослин спостерігали зі сполукою з прикладу 89, розкритого в патентній заявці WO-2009/016221, як показано в таблиці В3.

Таблиця В3:

Приклад	доза (ч./млн)	ефективність
28 з цього винаходу	500	95
30 з цього винаходу	500	90
89 з WO2009/016221	500	- (a)

Примітка а: 100 % пошкодження рослин.

Приклад 89, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2009/016221, відповідає N-циклопропіл-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[1-(1-нафтил)етил]-1H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/016221.

За таких самих умов спостерігали від високого (щонайменше 90 %) до повного захисту при дозі 500 ч./млн. активного інгредієнта зі сполуками 43 і 45 без будь-якого пошкодження рослин, тоді як від слабого захисту (менше ніж 30 %) до 90 % пошкодження рослин спостерігали зі сполуками з прикладів 236 та 263, розкритих в патентній заявці WO-2007/087906, як показано в таблиці В4.

Таблиця В4:

Приклад	доза (ч./млн)	ефективність
43 з цього прикладу	500	90
45 з цього прикладу	500	100
236 з WO2007/087906	500	30
263 з WO2007/087906	500	- (b)

Примітка b: 90 % пошкодження рослин.

Приклад 236, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2007/087906, відповідає N-циклопропіл-N-(2,4-дихлорбензил)-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду, а приклад 263, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2007/087906, відповідає N-циклопропіл-N-[1-(2,4-дихлорфеніл)етил]-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2007/087906.

Приклад С: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Pyrenophora teres* (ячмінь)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Через день після цієї обробки рослини інокулювали водною суспензією спор *Pyrenophora teres*. Рослини залишили на 48 годин в інкубаторному ящику при температурі 22 °C та відносній атмосферній вологості 100 %. Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 80 %.

Випробування оцінювали через 7-9 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 70 %) до повного (100 % боротьби з хворобою) захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці С:

Таблиця С:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
1	95	71	95	128	80
2	94	72	100	129	100
5	89	73	100	131	94
6	78	74	100	133	95
12	100	75	100	135	95
13	95	78	100	139	70
15	95	79	95	140	80
16	100	80	100	141	100
17	100	82	95	142	95
18	100	84	100	148	95
20	95	85	100	149	70
24	100	87	95	150	100
27	100	89	100	152	95
28	100	90	100	153	80
29	100	91	95	154	100
30	100	92	70	156	90
31	100	93	95	157	90
33	100	94	80	158	100
36	100	99	95	159	95
38	95	101	80	161	90
39	95	103	70	162	100
40	95	104	78	166	80
43	100	105	94	167	90
44	100	106	90	169	100
45	100	107	100	170	95
46	100	108	94	174	75
50	95	110	80	175	100
51	80	112	95	177	100
53	95	113	80	179	100
55	100	115	90	180	100
56	100	116	100	181	100
61	100	117	100	182	95
62	100	118	100	185	95
64	95	121	94	187	90
65	94	123	70	188	95
67	90	125	95	191	100
68	100	126	95	192	100
70	100	127	90		

- 5 За таких самих умов спостерігали добрий (щонайменше 70 %) і відмінний (щонайменше 95 %) захист при дозі 500 ч./млн. активного інгредієнта зі сполуками 123 і 135, тоді як відсутність захисту або слабкий захист (менше ніж 30 %) спостерігали зі сполуками з прикладів 145 і 146, розкритих в патентній заявці CN1188764, як показано в таблиці С2.

Таблиця С2:

10

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
123 з цього винаходу	500	70
135 з цього винаходу	500	95
145 з CN1188764	500	0
146 з CN1188764	500	20

Приклад 145, розкритий в міжнародній патентній заявці CN1188764, відповідає 5-хлор-1,3-диметил-N-[4-(трифторметил)бензил]-1H-піразол-4-карбоксаміду, а приклад 146, розкритий в міжнародній патентній заявці CN1188764, відповідає N-(4-tert-бутилбензил)-5-хлор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у CN1188764.

За тих самих умов спостерігали високий захист (щонайменше 80 %) при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполуками 127 та 128, тоді як не спостерігали будь-якого захисту зі сполукою з прикладу 24, розкритого у J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91, як показано в таблиці C3.

Таблиця C3:

Приклад	доза (ч./млн)	ефективність
127 з цього винаходу	500	90
128 з цього винаходу	500	80
24 з J.Korean.Agric. Chem.Soc (1992), 35, 87	500	0

Приклад 24, розкритий у J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91, відповідає 5-хлор-N-(4-хлорбензил)-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91.

Приклад D: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Leptosphaeria nodorum* (пшениця)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки або комбінації сполук змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробовування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки або комбінацією активних сполук при вказаній нормі нанесення. Через день після цієї обробки рослини інокулювали водною суспензією спор *Leptosphaeria nodorum*. Рослини залишили на 48 годин в інкубаторному ящику при температурі 22 °C та відносній атмосферній вологості 100 %. Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 22 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 90 %.

Випробування оцінювали через 7-9 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 70 %) до відмінного (щонайменше 95 %) захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці D:

Таблиця D:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
18	95	72	78	136	70
30	90	74	80	141	95
31	80	76	89	154	70
39	90	79	94	179	70
44	89	117	70	181	70
45	95	118	70	185	95
56	70	135	75	187	80

Приклад E: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Puccinia tritici* (пшениця)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки або комбінації активних сполук змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробовування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом

активної сполуки або комбінацією активних сполук при вказаній нормі нанесення.

Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини обприскали суспензією спор *Russinia tritici*. Рослини залишили на 48 годин в інкубаторному ящику при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 100 %.

5 Рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 80 %.

Випробування оцінювали через 8 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідає ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

10 За цих умов від доброго (щонайменше 70 %) до повного захисту спостерігали при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці E:

Таблиця E:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
29	80	100	80	141	95
68	70	101	90	180	80
90	95	106	80	181	70
98	95	117	70	184	70
99	100	126	78	185	90

15

За тих самих умов спостерігали добрий захист (щонайменше 80 %) при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 29, тоді як не спостерігали будь-якого захисту зі сполукою з прикладу 1.043, розкритого в патентній заявці WO-2009/024342, як показано в таблиці E2.

Таблиця E2:

20

Приклад	доза (ч./млн)	ефективність
29 з цього винаходу	500	80
1.043 з WO2009/024342	500	0

Приклад 1.043, розкритий у міжнародній патентній заявці WO-2009/024342, відповідає N-[1-(2,3-дихлорфеніл)етил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксаміду.

25

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/024342.

Приклад F: Профілактичне випробування в умовах *in vivo* на *Septoria tritici* (пшениця)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

30

Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки або комбінації активних сполук змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки або комбінацією активних сполук при вказаній нормі нанесення.

35

Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини обприскали суспензією спор *Septoria tritici*. Рослини залишили на 48 годин в інкубаторному ящику при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 100 %, а потім на 60 годин при температурі приблизно 15 °C у напівпрозорому інкубаторному ящику при відносній атмосферній вологості приблизно 100 %.

40

Рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 15 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 80 %.

Випробування оцінювали через 21 день після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідає ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

45

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 70 %) до повного захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці F:

Таблиця F:

Приклад	Ефективність
29	88
68	100
72	90
90	100
141	70
185	100

5 Приклад G: Профілактичне випробування в умовах *in vivo* на *Blumeria graminis* (ячмінь)

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

10 Для одержання підходящого препарату активної сполуки 1 частину за вагою активної сполуки або комбінації активних сполук змішали із вказаними кількостями розчинника та емульгатора, і концентрат розбавили водою до бажаної концентрації.

Для випробовування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки або комбінацією активних сполук при вказаній нормі нанесення.

Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини посипали спорами *Blumeria graminis* f.sp. *hordei*.

15 Рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 18 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 80 % для сприяння росту спорової маси плісняви.

Випробування оцінювали через 7 днів після інокуляції. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

20 За цих умов спостерігали повний захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці G:

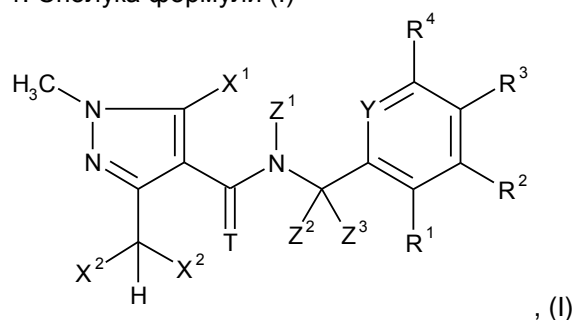
Таблиця G:

Приклад	Ефективність
68	100
72	100
90	100
141	100
185	100

25

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I)



30 де

Y означає CR⁵ або N;

T означає O або S;

X¹ і X², які можуть бути однаковими або різними, означають атом хлору або фтору;

35 Z¹ означає атом водню, заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкеніл; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкініл; заміщений або незаміщений C₄-C₇-циклоалкіл; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений 3-оксетаніл; або заміщений або незаміщений 3-тіетаніл;

Z^2 і Z^3 , які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкеніл; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкініл; ціано; ізонітрил; нітро; атом галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкенілокси; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкінілокси; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфаніл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфоніл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфініл; аміно; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксикарбоніл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; або заміщений або незаміщений N- C_1 - C_8 -алкіл- C_1 - C_8 -алкоксикарбамоїл; або Z^3 і R^1 разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5-, 6- або 7-членний, частково насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3-х гетероатомів, а Z^2 має описане тут значення; або Z^2 і Z^3 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і R^5 , які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; нітро; ціано; ізонітрил; гідроксил; сульфаніл; аміно; пентафтор- λ^6 -сульфаніл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси; C_1 - C_8 -галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C_1 - C_8 -алкокси- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфаніл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкеніл; C_2 - C_8 -галогеналкеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкініл; C_2 - C_8 -галогеналкініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкенілокси; C_2 - C_8 -галогеналкенілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкінілокси; C_2 - C_8 -галогеналкінілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; C_3 - C_7 -галогенциклоалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_2 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_2 - C_8 -алкеніл; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_2 - C_8 -алкініл; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_3 - C_7 -циклоалкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл- C_3 - C_7 -циклоалкіл; форміл; формілокси; форміламіно; карбокси; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; (гідроксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбоніл; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; N-(заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілокси)карбамоїл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксикарбамоїл; N-(заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл)-(заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси)карбамоїл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксикарбоніл; C_1 - C_8 -галогеналкоксикарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламінокарбоніл; дизаміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламінокарбоніл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбонілокси; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбонілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбоніламіно; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбоніламіно, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламінокарбонілокси; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламінокарбонілокси; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілоксикарбонілокси; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфініл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфоніл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксііміно; (C_1 - C_8 -алкоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений (C_1 - C_8 -алкенілоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; (C_1 - C_8 -алкінілоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; (бензілоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; три(заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл)силіл; три(заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл)силіл- C_1 - C_8 -алкіл; бензілокси, який може бути заміщений до 5 групами Q; бензілсульфаніл, який може бути заміщений до 5 групами Q; бензіламіно, який може бути заміщений до 5 групами Q; арил, який може бути заміщений до 7

- групами Q; арилокси, який може бути заміщений до 7 групами Q; ариламін, який може бути заміщений до 7 групами Q; арилсульфаніл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С₁-С₈алкіл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С₂-С₈-алкеніл, який може бути заміщений до 7 групами Q; арил-С₂-С₈-алкініл, який може бути заміщений до 7 групами Q;
- 5 піридиніл, який може бути заміщений до 4 групами Q; піридинілокси, який може бути заміщений до 4 групами Q; арил-С₃-С₇-циклоалкіл, який може бути заміщений до 7 групами Q; або два суміжні замісники R разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5- або 6-членний насичений карбо- або гетероцикл, що містить до 3-х гетероатомів, а інші замісники R мають описані тут значення; або
- 10 R¹ і Z³ разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений 5-, 6- або 7-членний, частково насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3-х гетероатомів, а R²-R⁵ мають описані тут значення;
- 15 Q, який може бути однаковим або різним, означає атом галогену; ціано; нітро; С₁-С₈-алкіл; С₁-С₈-алкокси; С₁-С₈-алкілсульфаніл; С₁-С₈-галогеналкіл, що містять до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; С₁-С₈-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; три(С₁-С₈)алкілсиліл або три(С₁-С₈)алкілсиліл-С₁-С₈-алкіл;
- а також її солі, N-оксиди, металеві комплекси, металоїдні комплекси та оптично-активні або геометричні ізомери.
- 20 2. Сполука за п. 1, в якій Y означає CR⁵.
3. Сполука за п. 1, в якій Y означає N.
4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, в якій T означає O.
5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, в якій X¹ означає атом фтору.
6. Сполука за будь-яким із пп. 1-5, в якій X² означає атом фтору.
- 25 7. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, в якій Z¹ означає атом водню.
8. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, в якій Z¹ означає метил або етил.
9. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, в якій Z¹ означає незаміщений циклобутил.
10. Сполука за будь-яким із пп. 1-9, в якій Z² і Z³ незалежно означають атом водню або метил.
11. Сполука за п. 10, в якій Z² означає атом водню і Z³ означає атом водню або метил.
- 30 12. Сполука за будь-яким із пп. 1-11, в якій R¹, R², R³, R⁴ і R⁵, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, атом галогену, заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкіл, С₁-С₈-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, заміщений або незаміщений С₃-С₇-циклоалкіл, три(С₁-С₈-алкіл)силіл або заміщений чи незаміщений С₁-С₈-алкілсульфаніл.
- 35 13. Сполука за п. 12, в якій замісник R¹ означає атом галогену, С₁-С₈-алкіл, С₁-С₈-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, С₃-С₇-циклоалкіл, три(С₁-С₈-алкіл)силіл або С₁-С₈-галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.
- 40 14. Сполука за будь-яким із пп. 1-13, в якій замісники R¹ і R⁵, які можуть бути однаковими або різними, означають атом галогену, С₁-С₈-алкіл, С₁-С₈-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, С₃-С₇-циклоалкіл, три(С₁-С₈-алкіл)силіл або С₁-С₈-галогеналкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.
- 45 15. Фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-14 та прийнятні для сільського господарства підкладку, носій або наповнювач.
- 50 16. Спосіб боротьби із фітопатогенними грибами культур рослин, який **відрізняється** тим, що агрономічно ефективну і по суті нефітотоксичну кількість сполуки за будь-яким із пп. 1-14 або фунгіцидної композиції за п. 15 наносять на ґрунт, де ростуть рослини або де вони можуть рости, на листя та/або плоди рослин, або на насіння рослин.

Комп'ютерна верстка М. 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