



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **109460**

(13) **C2**

(51) МПК

C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01)
A01N 43/74 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/828 (2006.01)
A01N 43/832 (2006.01)
A01N 43/836 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2013 06769	(72) Винахідник(и):	Бентінг Юрген (DE), Крісто П'єр (FR), Дахмен Пітер (DE), Деборде Філіп (FR), Гарі Стефан (FR), Шмідт Жан-Пітер (DE/FR), Вашендорф-Нейман Ульріке (DE)
(22) Дата подання заявки:	02.11.2011	(73) Власник(и):	БАЙЄР ІНТЕЛЕКЧУАЛ ПРОПЕРТІ ГМБХ, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, Germany (DE)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	25.08.2015	(74) Представник:	Льгова Майя Миколаївна, реєстр. №12
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	10356030.6, 61/472,374	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2009016222 A1, 05.02.2009 WO 2009016221 A1, 05.02.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	02.11.2010, 06.04.2011		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заяву:	EP, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	25.07.2013, Бюл.№ 14		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	25.08.2015, Бюл.№ 16		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	РСТ/EP2011/069206, 02.11.2011		

(54) N-ГЕТАРИЛМЕТИЛПІРАЗОЛІЛКАРБОКСАМІДИ

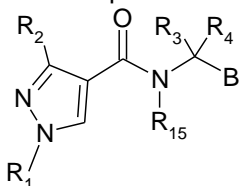
(57) Реферат:

Цей винахід стосується похідних N-гетарилметилпіразолілкарбоксамідів або 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 109460 C2

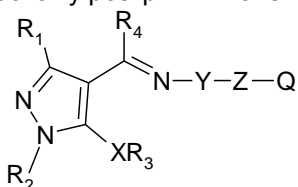
Цей винахід стосується похідних N-гетарилметил піразолілкарбоксаміду або їхніх тіокарбоксамідних похідних, способу їх одержання, їх застосування як фунгіцидів, зокрема у вигляді композицій, та способів боротьби з фітопатогенними грибами рослин, особливо рослин, із застосуванням цих сполук або композицій.

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



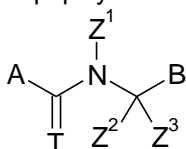
де R₁ може означати алкільну групу, R₂ може означати галогеналкільну групу, R₁₅ може означати атом водню або циклопропільну групу, R₃ або R₄ можуть означати різні замісники, з-поміж яких алкільна група, галогеналкільна група та подібне, а B може означати 5-10-членну моноциклічну або конденсовану гетероароматичну кільцеву систему, що містить від одного до трьох гетероатомів. 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 патентній заявці CN1188764 загалом охоплені деякі фунгіцидні похідні піразолу у широкому розкритті численних сполук такої формули:



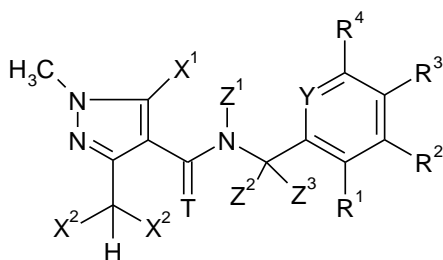
де R₁ або R₂ можуть означати алкільну групу або галогеналкільну групу, X може означати прямий зв'язок, R₃ може означати різні замісники, з-поміж яких атом хлору, R₄ може означати різні замісники, з-поміж яких атом кисню або сірки, Y і Z можуть означати прямий зв'язок, а Q може означати різні групи, з-поміж яких заміщена бензильна група. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, що містить алкільну групу, алкокси групу або 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-2008/015189, WO-2008/037789, WO-2009/016221 та WO-2009/016222 загалом охоплені деякі амідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



де A може означати карбо-сполучену, частково насичену або ненасичену, 5-членну гетероциклічну групу, яка може бути заміщена, Z може означати (не)заміщену циклоалкільну групу, а B може означати різні моноциклічні або конденсовані 5 і 6-членні гетероароматичні кільця. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, яка містить атом водню, алкільну групу або алкокси групу, сполучені з атомом азоту карбоксамідного залишку. Крім того, цей документ чітко не розкриває і не пропонує вибирати будь-яку таку похідну, в якій A може означати 1-метил-3-(дифтор або дихлор)метил-5-(хлор або фтор)-4-піразолільну групу.

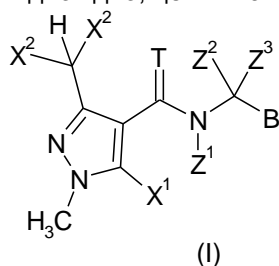
У міжнародній патентній заявці WO-2010/130767 загалом охоплені деякі амідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



де X^1 і X^2 можуть означати атом хлору або фтору, Т може означати О або S, Z^1 може означати (не)заміщену циклопропілну групу, Z^2 і Z^3 можуть означати водень, алкільну групу та подібне, Y може означати N або CHR^5 , R^1 - R^5 можуть означати різні замісники, а два сусідні замісники R разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати (не)заміщений 5- або 6-членний, насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3 гетероатомів. Однак, цей документ не розкриває і не пропонує будь-якої сполуки, яка містить атом водню, алкільну групу або алкокси групу, сполучені з атомом азоту карбоксамідного залишку. Крім того, цей документ чітко не розкриває і не пропонує вибирати будь-яку таку похідну, в якій фенільне або 2-піридилне кільце можуть бути заміщені іншим ненасиченим моноциклічним або конденсованим біциклічним гетероароматичним кільцем.

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)



де

- Т означає О або S;

- X^1 і X^2 , які можуть бути однаковими або різними, означають атом хлору або фтору;

- Z^1 означає атом водню, заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкеніл; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкініл; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений 3-оксетаніл; або заміщений чи 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; ізонітрil; 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; амін; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламін; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламін; 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 чи незаміщений N - C_1 - C_8 -алкіл- C_1 - C_8 -алкокси-карбамоїл; або

- Z^2 і Z^3 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений C_3 - C_7 циклоалкіл; або

- Z^3 і замісник X, сусідній до точки прикріплення B-групи, разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати 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;

- В означає насичене, частково насичене або ненасичене, моноциклічне або конденсоване біциклічне 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 10-членне кільце, що містить від 1 до 4 гетероатомів, вибраних з переліку, що складається з N, O, S, які можуть бути заміщені до шістьма групами X, які можуть бути однаковими або різними; за умови, що В не означає 2-піридилъне кільце, і що В не означає 1,3-бензодіоксолільное кільце, коли Z^1 означає заміщену або незаміщену циклопропільну групу;

- Х означає атом галогену; нітро; ціано; ізонітрил; гідрокси; амін; сульфаніл; пентафтор-λ⁶-сульфаніл; форміл; формілокси; форміламін; заміщений або незаміщений (гідроксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₁-C₈-алкоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₂-C₈-алкенілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₂-C₈-алкінілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (бензілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; карбокси; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-галогеналкеніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-галогеналкініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіламін; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеналкенілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₃-C₈-алкінілокси; C₂-C₈-галогеналкінілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-галогенциклоалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений (C₃-C₇-циклоалкіл)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₃-C₇-циклоалкіл)-C₂-C₈-алкеніл; заміщений або незаміщений (C₃-C₇-циклоалкіл)-C₂-C₈-алкініл; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбонілокси; C₁-C₈-галогеналкілкарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбоніламін; C₁-C₈-галогеналкіл-карбоніламін, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-галогеналкоксикарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілоксикарбонілокси; C₁-C₈-галогеналкоксикарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ді-C₁-C₈-алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіламінкарбонілокси; заміщений або незаміщений ді-C₁-C₈-алкіламінкарбонілокси; заміщений або незаміщений N-(C₁-C₈-алкіл)гідроксикарбамоїл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; заміщений або незаміщений N-(C₁-C₈-алкіл)-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; арил, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкіл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-арилалкеніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-арилалкініл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилокси, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилсульфаніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; ариламін, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкілокси, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкілсульфаніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або C₁-C₈-арилалкіламін, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або

- два замісники Х разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений карбоцикл, який може бути заміщений до чотирма групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або

- Z^3 і замісник Х, сусідній до точки прикріплення В-групи, разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати 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;

- Q незалежно означає атом галогену; ціано; нітро; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₈-

алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₁-C₈-алкоксіміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (бензилоксіміно)-C₁-C₈-алкіл;

5 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:

10 атом галогену; нітро; гідроксил; ціано; ізонітріл; амін; тіо; пентафтор-λ⁶-сульфанільна група; форміл; формілокси; форміламін; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; (гідроксіміно)-C₁-C₆-алкіл; C₁-C₈-алкіл; трі(C₁-C₈-алкіл)силіл; C₃-C₈-циклоалкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₃-C₈-галогенциклоалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-алкінілокси; C₁-C₈-алкіламін; ді-C₁-C₈-алкіламін; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеналкенілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₃-C₈-алкінілокси; C₃-C₈-галогеналкінілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 5 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 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбонілокси; C₁-C₈-галогеналкілкарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілкарбоніламін; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніламін, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкіламінкарбонілокси; ді-C₁-C₈-алкіламін-карбонілокси; C₁-C₈-алкілоксикарбонілокси; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; C₁-C₈-алкіламінсульфамоїл; ді-C₁-C₈-алкіламінсульфамоїл; (C₁-C₆-алкоксіміно)-C₁-C₆-алкіл; (C₁-C₆-алкенілоксіміно)-C₁-C₆-алкіл; (C₁-C₆-алкінілоксіміно)-C₁-C₆-алкіл; 2-оксопіролідін-1-іл; (бензилоксіміно)-C₁-C₆-алкіл; C₁-C₈-алкоксіалкіл; C₁-C₈-галогеналкоксіалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; бензилокси; бензилсульфаніл; бензиламін; арилокси; арилсульфаніл або ариламін.

35 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:

40 - 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
 45 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 Z¹ означає незаміщений циклопропіл.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z¹ означає атом водню.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z¹ означає метил або етил.

55 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.

60 Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких X² означає атом фтору.

Іншими сполуками формули (I) за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки, в яких Z^2 та 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, а Z^3 означає атом водню або метил.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), в яких В означає заміщене або незаміщене тієнільне кільце; заміщене або незаміщене бензотієнільне кільце; заміщене або незаміщене хінолінільне кільце; заміщене або незаміщене ізохінолінільне кільце; або заміщене чи незаміщене бензофуранове кільце.

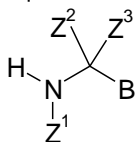
Сполуками за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки формули (I), в яких В означає заміщене або незаміщене тієнільне кільце. Іншими сполуками за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки формули (I), в яких В означає заміщене або незаміщене бензотієнільне кільце. Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), в яких Х незалежно означає 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_1 - C_8 -алкокси або C_1 - C_8 -галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

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 Т з кращими ознаками одного або більше з X^1 , X^2 , Z^1 - Z^3 , В та Х;
- кращі ознаки X^1 з кращими ознаками одного або більше з Т, X^2 , Z^1 - Z^3 , В та Х;
- кращі ознаки X^2 з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , Z^1 - Z^3 , В та Х;
- кращі ознаки Z^1 з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , X^2 , Z^2 , Z^3 , В та Х;
- кращі ознаки Z^2 з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , X^2 , Z^1 , Z^3 , В та Х;
- кращі ознаки Z^3 з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , X^2 , Z^2 , Z^4 , В та Х;
- кращі ознаки В з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , X^2 , Z^1 - Z^3 та Х;
- кращі ознаки Х з кращими ознаками одного або більше з Т, X^1 , X^2 , Z^1 - Z^3 та В;

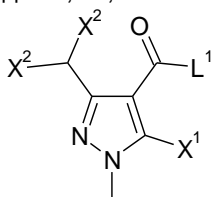
У цих комбінаціях кращих ознак замісників сполук за винаходом згадані кращі ознаки можуть також бути вибрані із ще кращих ознак кожного з Т, X^1 , X^2 , Z^1 - Z^3 , В та Х для утворення найкращих підкласів сполук за винаходом.

Цей винахід також стосується способу одержання сполуки формули (I). Отже, відповідно до іншого аспекту цього винаходу забезпечений спосіб Р1 одержання сполуки формули (I), як визначено у цьому описі, в якій Т означає О 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 та В 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 конденсуючого 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 ("Література з біоорганіки та медичної хімії") (2006), 2014), або відновлюванням імінів (Tetrahedron ("Тетраедр") (2005), 11689), або нуклеофільним заміщенням

галогену, мезилату чи тозилату (Journal of Medicinal Chemistry ("Журнал з медичної хімії") (2002), 3887).

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

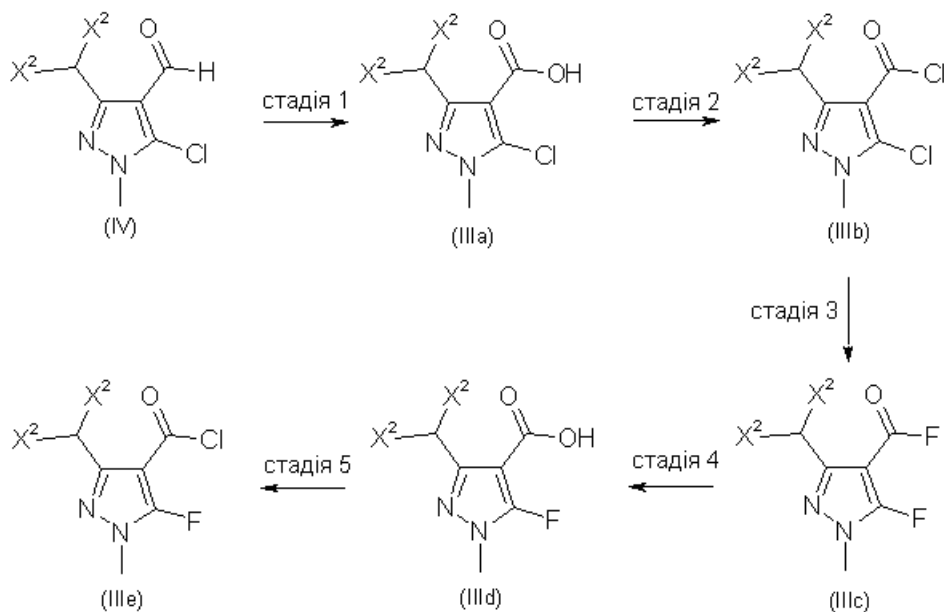
У разі, якщо L^1 означає гідроксигрупу, спосіб за цим винаходом проводять у присутності конденсувального агента. Підходящий конденсувальний агент може бути вибраний з необмеженого переліку, що складається з утворювача галоїдної кислоти, такого як фосген, трибромід фосфору, трихлорид фосфору, пентахлорид 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 (T3P).

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-диметиланілін, піридин, N-метилпіперидин, 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 похідних формули (III), в якій T означає O, який проілюстрований такою схемою реакції:



Спосіб P2

де X^2 має визначене тут значення;

5-хлор-3-(дифторметил)-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.

5 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.

10 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.

20 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 тетрахлорид-трифенілфосфіну вуглецю.

25 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.

30 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.

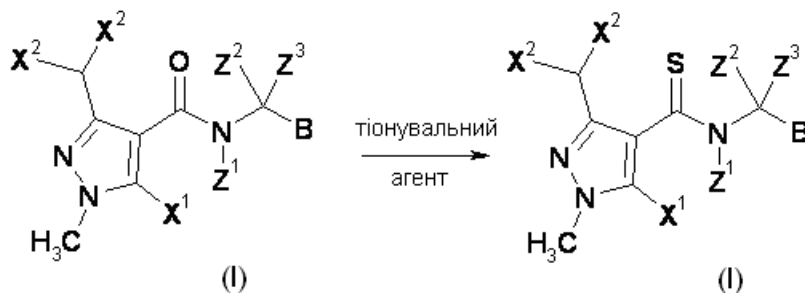
35 При здійсненні стадії 1 способу P2 за винаходом звичайно використовують один моль або надлишкову кількість окислювача на моль альдегіду формули (IV). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

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 (IIIId). Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

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

45 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:



50 Спосіб P3

де X^1 , X^2 , Z^1 , Z^2 , Z^3 та В мають визначені тут значення, у необов'язковій присутності каталітичної або стехіометричної чи більшої 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-метилпіперидин.

Спосіб РЗ за винаходом проводять у присутності тіонувального агента.

Вихідні амідні похідні формули (I) можуть бути одержані відповідно до способу Р1.

Підходящими тіонувальними агентами для здійснення способу РЗ за винаходом можуть бути сірка (S), сульфгідрильна кислота (H_2S), сульфід натрію (Na_2S), гідросульфід натрію ($NaHS$), трисульфід бору (B_2S_3), сульфід біс(діетилалюмінію) ($(AlEt_2)_2S$), 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 лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової або нафталенсульфонової 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 поліоксіетильованих 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, покрите 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) бромконазол (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) флукхіконазол (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) протіконазол (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-метоксифенокс)-3,3-диметилбутан-2-іл]¹H-імідазол-1-карботіоат (111226-71-2);

(2) інгібітори дихального ланцюга в комплексі I або II, наприклад (2.1) біксафен (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-(три фтор-метил)-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-метан-нафтален-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) енестроурин (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) трифлуксистробін (141517-21-7) (WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-{2-[[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпіримідин-4-іл]окси]феніл}-2-(метоксііміно)-N-метилетанамід (WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(метоксііміно)-N-метил-2-{2-[[{(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден}амін]окси]метил]феніл}етанамід (WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(метоксііміно)-N-метил-2-{2-[[{(E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етоксі]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-(метоксііміно)-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-(метоксііміно)-N-метил-етанамід, (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-гідроксибензамід (226551-21-9), (3.32) 2-{2-[[2,5-диметилфенокси]метил]феніл}-2-метокси-N-метилацетамід (173662-97-0) і (3.33) (2R)-2-{2-[[2,5-диметилфенокси]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-тетрарметил-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-метилбензоїл)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) оксациксил (77732-09-3) та (12.13) оксолінова кислота (14698-29-4);

(13) інгібітори сигнальної трансдукції, наприклад (13.1) хлоролінат (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) флуазилам (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-tert-бутилфеніл)-3-(2-хлорпіридин-4-іл)-1-(морфолін-4-іл)проп-2-ен-1-он (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-tert-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) теклофалам (76280-91-6), (15.49) толніфанід (304911-98-6), (15.50) тріазоксид (72459-58-6), (15.51) трихламід (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)-¹H-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)-¹H-піразол-1-іл]етанон (1003319-80-9) (WO 2008013622), (15.56) 1-(4-{4-[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)-¹H-піразол-1-іл]етанон (1003318-67-9) (WO 2008013622), (15.57) 1-(4-метоксифенокси)-3,3-диметилбутан-2-іл ¹H-імідазол-1-карбоксилат (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин (13108-52-6), (15.59) 2,3-дibuтил-6-хлортієно[2,3-d]піримідин-4(3H)-он (221451-58-7), (15.60) 2,6-диметил-¹H, 5H-[1,4]дитііно[2,3-c:5,6-c']дипірол-1,3,5,7(2H, 6H)-тетрон, (15.61) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-¹H-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)-¹H-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)-¹H-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-4H-хромен-4-он, (15.65) 2-хлор-5-[2-хлор-1-(2,6-дифтор-4-метоксифеніл)-4-метил-¹H-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-сульфонгідразид (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-a]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-tert-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-тетрагідро-нафтален-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) tert-бутил {6-[[[(1-метил-¹H-тетразол-5-іл)(феніл)метилен]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)метиле]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, октиліон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші препарати міді.

Інсектициди/акарициди/нематодіциди:

(1) інгібітори ацетилхолінестерази (AChE), наприклад:

карбамати, наприклад, аланікарб, альдикарб, бендіокарб, бенфуракарб, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, етіофенкарб, фенобукарб, форметанат, фураціокарб, ізопрокарб, метіокарб, метоміл, метолкарб, оксаміл, піримікарб, пропоксур, тіодикарб, тіофанокс, тріазамат, триметакрб, ХМС та ксилікарб; 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, іміціафос, ізофенфос, ізопропіл O-(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, тебупіримфос, 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 нікотинового ацетилхолінового рецептору (nAChR), наприклад: неонікотиноїди, наприклад, ацетаміпрід, клотіанідин, динотефуран, імідаклопрід, нітенпірам, тіаклопрід і тіаметоксам; або нікотин;

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

(6) активатори хлоридного каналу, наприклад: авермектини/мільбеміцини, наприклад, абамектин, емабектин бензоат, лепіmekтин і мільбемектин;

10 (7) міміки ювенільного гормону, наприклад: аналоги ювенільного гормону, наприклад, гідропрес, кінопрен і метопрен; або феноксикарб; або пірипроксифен.

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

15 галіди алкілів, наприклад, бромід метилу та інші галіди алкілів; або хлорпікрин; або фторид сульфурилу; 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;

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

(12) інгібітори мітохондрійної АТФ-синтази, наприклад, діафентіурон; або оловоорганічні майтициди, наприклад, азоциклотин, цигексатин і фенбутатиноксид; або пропангіт; або тетрадифон;

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

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

30 (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;

35 (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;

40 (21) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу I, наприклад: METI акарициди, наприклад, феназахін, фенпіроксимат, піримідифен, піридабен, тебуфенпірад і толфенпірад; або ротенон (Дерріс);

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

45 (23) інгібітори ацетил СоА карбоксилази, наприклад: похідні тетранової і тетрамової кислот, наприклад, спіродиклофен, спіромезифен і спіротетрамат;

(24) інгібітори перенесення електронів мітохондрійного комплексу IV, наприклад: фосфіни, наприклад, фосфід алюмінію, фосфід кальцію, фосфін і фосфід цинку; або 50 ціанід;

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

(28) модулятори ріанодинового рецептору, наприклад: діаміни, наприклад, хлорантраніліпрол і флубендіамід.

55 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, 60 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-циклопропілметил)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-[[6-хлорпіридин-3-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), флупірадифулон, 4-[[6-хлор-5-фторпіридин-3-іл)метил](метил)аміно}фуран-2(5H)-он (відомий з WO2007/115643), 4-[[5,6-дихлор-піридин-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-[(циклопропіл-карбоніл)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, 1H-бензо[*f*]пірано[4,3-*b*]хромен-4-іл]метил циклопропанкарбоксилат (відомий з WO2008/066153), 2-ціано-3-(дифторметокси)-N, N-диметилбензолсульфонамід (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-(трифтор-метил)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-оксо-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-метилгідазинкарбоксилат (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-етилгідазинкарбоксилат (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-метилгідазинкарбоксилат (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-дібром-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-пропоксіімідазо[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-(трифтор-метил)-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 коренів. Спосіб обробки за винаходом 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),
 5 *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),
 10 *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, цвітня 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),
 15 *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 індують 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 оброблення 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-енолпірувілшкімат-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 кодуєть 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 декарбоксілази, 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 гербіцидів, 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 гербіцидів 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 гербіцидів рослинами є рослини, яким надана толерантність до інгібіторів ацетолактатсинтази (ALS). Відомі інгібітори ALS включають, наприклад, сульфонілсечовину, імідазоліон, тріазолпіримідини, піримідинілокси(тіо)бензоати та/або сульфоніламінокарбонілтріазолінонові гербіциди. Різні мутації в ензимі ALS (також відомої як ацетогідроксикислотна синтаза, AHAS) відомі як такі, що надають толерантність до різних гербіцидів і груп гербіцидів, 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 імідазоліону 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 імідазоліону 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 гербіциду або мутаційним
5 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
10 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
15 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 i Molecular Biology Reviews* ("Огляди мікробіології та молекулярної біології"), 62:
20 *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 №
25 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
30 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, внесених 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
40 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
45 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;
50 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;
55 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
60 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 динуклеотидсинтезазу або нікотинамід фосфорибозилтрансферазу, як це описано, наприклад, у EP 04077624.7, WO 2006/133827, PCT/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 стробування 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;

ф) 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 2007/0022496 WO 2000/063432	WO 2004/049786
Стійкість до ервінії (мокрої 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	Соя	Толерантний до гербіцидів	DAS-68416-4
09-328-01p		Bayer Crop Science	Соя	Толерантний до гербіцидів	FG72
09-233-01p		Dow	Кукурудза	Толерантний до гербіцидів	DAS-40278-9
09-201-01p		Monsanto	Соя		MON-87705-6
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 плодючістю	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 плодючістю, візуальний маркер	DP-32138-1
08-315-01p		Florigene	Троянда	Зі зміненим кольором квітів	IFD-52401-4 і IFD-52901-9
07-253-01p		Syngenta	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих	MIR-162 Maїс
07-108-01p		Syngenta	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	COT67B
06-354-01p		Pioneer	Соя	З високим вмістом олеїнової кислоти	DP-305423-1
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
06-298-01p		Monsanto	Куку-рудза	Стійка до метелика кукурудзяного	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	Соя	Толерантний до гліфосату та ацетолатсинтази	356043 (DP-356043-5)
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	Куку-рудза	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	Куку-рудза	Високولیзиновий	LY038
04-125-01p		Monsanto	Куку-рудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	88017
04-086-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	MON 88913
03-353-01p		Dow	Куку-рудза	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	Куку-рудза	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	Topas 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
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 CPV	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
97-013-01p		Calgene	Бавовна	Толерантний до бромксинілу та стійкий до лускокрилих	Події 31807 та 31808
97-008-01p		Du Pont	Соя	Зі зміненим 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	Куку-рудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі змінним 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	Куку-рудза	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 змінним дозріванням плодів	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	Бавовна	Толерантний до сульфонісечовини	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	Куку-рудза	З чоловічою стерильністю	MS3
95-195-01p		Northrup King	Куку-рудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі змінним дозріванням плодів	2 додаткові лінії FLAVRSAVR
95-145-01p		DeKalb	Куку-рудза	Толерантний до фосфінотрицину	B16
95-093-01p		Monsanto	Куку-рудза	Стійкий до лускокрилих	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	Томати	Зі змінним дозріванням плодів	8338
95-045-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі змінним дозріванням плодів	20 додаткових ліній FLAVRSAVR
94-357-01p		AgrEvo	Куку-рудза	Толерантний до фосфінотрицину	T14, T25

94-319-01p		Ciba Seeds	Куку-рудза	Стійкий до лускокрилих	Подія 176
94-308-01p		Monsanto	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca та Petoseed	Томати	Зі зниженим рівнем полігалактуранази 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
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 глюкофозинату	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:

- 5 Хвороби борошнистої роси, такі як:
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*;
- 10 Хвороби іржавіння, такі як:
Хвороби гімноспорангію (*Gymnosporangium*), спричинені, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*;
Хвороби гемілеї (*Hemileia*), спричинені, наприклад, *Hemileia vastatrix*;
Хвороби факосори (*Phakopsora*), спричинені, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або
- 15 *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:
- 20 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*;
- 25 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:
- 30 Хвороби альтернатії (*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*), синонім: гельмінтоспоріум (*Helminthosporium*) або *Cochliobolus miyabeanus*;
- 35

- Хвороби колетотрихуму (*Colletotrichum*), спричинені, наприклад, *Colletotrichum lindemuthianum*;
- Хвороби циклоконію (*Cycloconium*), спричинені, наприклад, *Cycloconium oleaginum*;
- Хвороби діапорте (*Diaporthe*), спричинені, наприклад, *Diaporthe citri*;
- 5 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*;
- 10 *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*;
- 15 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*;
- 20 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*;
- 25 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*;
- 30 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*;
- 35 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*;
- 40 Хвороби монографели (*Monographella*), спричинені, наприклад, *Monographella nivalis*;
- Хвороби головні та мокрої головні, такі як:
- Хвороби сфацелотеки (*Sphacelotheca*), спричинені, наприклад, *Sphacelotheca reiliana*;
- Хвороби тилетії (*Tilletia*), спричинені, наприклад, *Tilletia caries*;
- Хвороби уроцистису (*Urocystis*), спричинені, наприклад, *Urocystis occulta*;
- 45 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*;
- 50 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:
- 55 Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, *Alternaria brassicicola*;
- Хвороби афаноміцесу (*Aphanomyces*), спричинені, наприклад, *Aphanomyces euteiches*;
- Хвороби аскохіта (*Ascochyta*), спричинені, наприклад, *Ascochyta lentis*;
- Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
- Хвороби кладоспорію (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, *Cladosporium herbarum*;

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*;

5 Хвороби гіберели (*Gibberella*), спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;

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*;

10 Хвороби фомопсису (*Phomopsis*), спричинені, наприклад, *Phomopsis sojae*;

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*;

15 Хвороби ризоктонії (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;

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*;

20 Хвороби вертицилію (*Verticillium*), спричинені, наприклад, *Verticillium dahliae*;

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*;

25 Хвороби пухирчастості або закручування листя, такі як:

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 clamydospora*;

30 Хвороби еутипа дайбек (*Eutypa dyebek*), спричинені, наприклад, *Eutypa lata*;

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*;

35 Хвороби бульби, такі як:

Хвороби ризоктонію (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;

Хвороби гельмінтоспорію (*Helminthosporium*), спричинені, наприклад, *Helminthosporium solani*;

Хвороби кіли хрестоцвітних, такі як:

40 Хвороби плазмодіофори (*Plasmodiophora*), спричинені, наприклад, *Plasmodiophora brassicae*;

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*.

45 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.

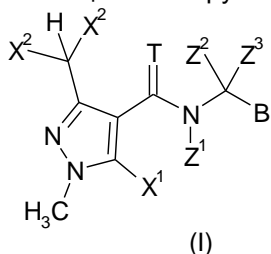
50 Доза активної сполуки, яку звичайно наносять способом обробки відповідно до винаходу, звичайно і переважно становить від 10 до 800 г/га, краще від 50 до 300 г/га для нанесення при обробці листя. Доза нанесеної активної речовини звичайно і переважно становить від 2 до 200 г на 100 кг насіння, краще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

55 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 logP визначали відповідно до директиви ЄЕС 79/831, Додаток V.A8, шляхом ВЕРХ (високоєфективної рідинної хроматографії) на колонці зі зворотною фазою (С 18) із використанням описаного нижче способу:

Температура: 40 °С; 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 logP (визначення значень logP часом утримування із використанням лінійної інтерполяції між двома послідовними алканонами). Максимальні значення лямбда визначали із використанням УФ-спектру від 200 нм до 400 нм та пікових значень хроматографічних сигналів.

Таблиця 1:



Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
1	F	F	O	метил	H	H	2-фурил	1,87	288
2	Cl	F	O	1-циклопропіл етил	H	H	2-фурил	2,98	358
3	F	F	O	1-циклопропіл етил	H	H	2-фурил	2,82	342
4	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2-фурил	2,45	330
5	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-фурил	2,32	314
6	Cl	F	O	метил	H	H	2-фурил	2,02	304
7	Cl	F	O	циклогексил	H	H	2-фурил	3,35	372
8	F	F	O	циклогексил	H	H	2-фурил	3,21	356
9	Cl	F	O	H	H	H	2-фурил	1,86	290
10	F	F	O	H	H	H	2-фурил	1,66	274
11	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-фурил	2,86	344
12	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-фурил	2,70	328
13	Cl	F	O	2,2,2- трифторетил	H	H	піридин-3-іл	1,37	383
14	F	F	O	2,2,2- трифторетил	H	H	піридин-3-іл	1,20	367
15	Cl	F	O	циклогептил	H	H	піридин-3-іл	1,76	397
16	F	F	O	циклогептил	H	H	піридин-3-іл	1,66	381
17	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		піридин-3-іл	0,96	355
18	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		піридин-3-іл	0,84	339
19	Cl	F	O	метил	i-Pr ⁽¹⁾	H	піримідин-5-іл	1,76	358
20	F	F	O	метил	i-Pr	H	піримідин-5-іл	1,65	342

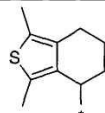
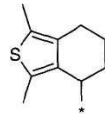
Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
21	Cl	F	O	метил	H	H	3-метил-2-фурил	2,32	318
22	F	F	O	метил	H	H	3-метил-2-фурил	2,18	302
23	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-метил-3-фурил	3,11	358
24	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-метил-3-фурил	2,92	342
25	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-метил- 1H-піразол-3-іл	1,93	358
26	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-метил- 1H-піразол-3-іл	2,25	342
27	Cl	F	O	етил	H	H	4-метил- 1,2,5-оксадіазол- 3-іл	2,20	334
28	F	F	O	етил	H	H	4-метил- 1,2,5-оксадіазол- 3-іл	2,05	318
29	Cl	F	O	пропіл	H	H	2-тієніл	2,90	348
30	F	F	O	пропіл	H	H	2-тієніл	2,77	332
31	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2-тієніл	2,73	346
32	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-тієніл	2,59	330
33	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-тієніл	3,13	360
34	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-тієніл	2,96	344
35	F	F	O	циклопропіл	Me ⁽¹⁾	H	2,5-диметил-3- фурил	3,21	356
36	Cl	F	O	циклопропіл	Me	H	2,5-диметил-3- фурил	3,37	372
37	Cl	F	O	циклопентил	H	H	3-метил-2-тієніл	3,61	388
38	F	F	O	циклопентил	H	H	3-метил-2-тієніл	3,46	372
39	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-метил-2-тієніл	3,02	360
40	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-метил-2-тієніл	2,88	344

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
41	Cl	F	O	метил	H	H	3-метил-2-тієніл	2,58	334
42	F	F	O	метил	H	H	3-метил-2-тієніл	2,44	318
43	Cl	F	O	аліл	H	H	2-метил- 1,3-тіазол-4-іл	2,20	361
44	F	F	O	аліл	H	H	2-метил- 1,3-тіазол-4-іл	2,07	345
45	F	F	O	етил	H	H	1-етил-3-метил- 1H-піразол-4-іл	1,69	344
46	Cl	F	O	етил	H	H	1-етил-3-метил- 1H-піразол-4-іл	1,79	360
47	F	F	O	H	H	H	1-етил-3-метил- 1H-піразол-4-іл	1,31	316
48	F	F	O	циклопропіл	Me	H	2,5-диметил-3- тієніл	3,62	372
49	Cl	F	O	циклопропіл	Me	H	2,5-диметил-3- тієніл	3,79	388
50	F	F	O	циклопропіл	Me	H	2-хлорпіридин-3- іл	2,23	373
51	Cl	F	O	метил	H	H	2-хлорпіридин-3- іл	1,87	349
52	F	F	O	метил	H	H	2-хлорпіридин-3- іл	1,72	333
53	Cl	F	O	метил	H	H	2-хлорпіридин-4- іл	1,91	349
54	F	F	O	метил	H	H	2-хлорпіридин-4- іл	1,76	333
55	Cl	F	O	метил	H	H	5-хлорпіридин-3- іл	1,90	349
56	F	F	O	метил	H	H	5-хлорпіридин-3- іл	1,76	333
57	F	F	O	циклопентил	H	H	6-хлорпіридин-3- іл	2,80	387
58	Cl	F	O	2-метокси етил	H	H	6-хлорпіридин-3- іл	2,15	393
59	F	F	O	2-метокси етил	H	H	6-хлорпіридин-3- іл	2,02	377
60	Cl	F	O	етил	H	H	6-хлорпіридин-3- іл	2,23	363

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
61	F	F	O	етил	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,10	347
62	Cl	F	O	метил	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	1,98	349
63	F	F	O	метил	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	1,84	333
64	Cl	F	O	ізопропіл	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,49	377
65	F	F	O	ізопропіл	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,33	361
66	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,39	375
67	F	F	O	циклопропіл	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,25	359
68	Cl	F	O	циклопентил	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	2,94	403
69	Cl	F	O	H	H	H	6-хлорпіридин-3-іл	1,82	335
70	F	F	O	циклопропіл	Me	H	1-бензофуран-2-іл	3,42	378
71	F	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензофуран-2-іл	3,11	364
72	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензофуран-2-іл	3,21	380
73	F	F	S	циклопропіл	H	H	1-бензофуран-2-іл	3,76	380
74	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-бензофуран-2-іл	3,70	394
75	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-бензофуран-2-іл	3,52	378
76	F	F	O	етил	H	H	2-хлор-1,3-тіазол-5-іл	2,21	353
77	Cl	F	O	етил	H	H	2-хлор-1,3-тіазол-5-іл	2,35	369
78	Cl	F	O	етил	H	H	1-етил-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл	1,82	374
79	F	F	O	етил	H	H	1-етил-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл	1,72	358
80	F	F	O	циклопропіл	Me	H	1-бензотіофен-2-іл	3,69	394

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
81	Cl	F	O	H	Me	H	1-бензотіофен-2-іл	3,13	370
82	F	F	O	H	Me	H	1-бензотіофен-2-іл	2,98	354
83	Cl	F	O	H	H	H	1-бензотіофен-2-іл	2,92	356
84	F	F	O	H	H	H	1-бензотіофен-2-іл	2,75	340
85	F	F	O	циклопропіл	Me	H	1-бензотіофен-3-іл	3,60	394
86	F	F	S	циклопропіл	Me	H	1-бензотіофен-3-іл	4,44	410
87	Cl	F	O	H	H	H	1-бензотіофен-3-іл	2,90	356
88	F	F	O	H	H	H	1-бензотіофен-3-іл	2,73	340
89	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-3-іл	3,41	396
90	F	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-3-іл	3,27	380
91	F	F	O	циклопропіл	Me	H	1-бензотіофен-7-іл	3,44	394
92	Cl	F	O	циклопропіл	Me	H	1-бензотіофен-7-іл	3,61	410
93	F	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-7-іл	3,19	380
94	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-7-іл	3,31	396
95	F	F	S	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-7-іл	3,83	396
96	F	F	S	циклопропіл	H	H	1-бензотіофен-7-іл	4,16	410
97	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	1,3-бензотіазол-2-іл	2,80	397
98	F	F	O	циклопропіл	H	H	1,3-бензотіазол-2-іл	2,68	381
99	Cl	F	O	метил	H	H	2,1,3-бензотіадіазол-5-іл	2,32	372
100	F	F	O	метил	H	H	2,1,3-бензотіадіазол-5-іл	2,17	356

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
101	Cl	F	O	метил	H	H	6-ізопропокси піридин-3-іл	2,59	373
102	F	F	O	метил	H	H	6-ізопропокси піридин-3-іл	2,45	357
103	Cl	F	O	H				2,90	346
104	F	F	O	H				2,73	330
105	F	F	O	метил	H	H	3-(2,2-диметил- пропіл)- 1,2-оксазол-5-іл	2,75	359
106	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-(2,2-диметил- пропіл)- 1,2-оксазол-5-іл	3,17	385
107	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-(2,2-диметил- пропіл)- 1,2-оксазол-5-іл	3,31	401
108	Cl	F	O	метил	H	H	1-феніл-1H- піразол-4-іл	2,40	380
109	F	F	O	метил	H	H	1-феніл-1H- піразол-4-іл	2,26	364
110	F	F	O	метил	H	H	3-феніл- 1,2-оксазол-5-іл	2,51	365
111	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-феніл- 1,2-оксазол-5-іл	2,92	391
112	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-феніл- 1,2-оксазол-5-іл	3,04	407
113	Cl	F	O	метил	H	H	3-феніл- 1,2,4-оксадіазол- 5-іл	2,71	382
114	F	F	O	метил	H	H	3-феніл- 1,2,4-оксадіазол- 5-іл	2,58	366
115	F	F	O	циклопропіл	H	H	3,5- дихлорпіридин-4- іл	2,54	393
116	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3,5- дихлорпіридин-4- іл	2,64	409
117	F	F	S	циклопропіл	H	H	3,5- дихлорпіридин-4- іл	3,29	409

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
118	F	F	O	циклопропіл	H	H	4,6-дихлорпіридин-3-іл	2,73	393
119	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	4,6-дихлорпіридин-3-іл	2,90	409
120	Cl	F	O	циклопропіл	Me	H	5,6-дихлорпіридин-3-іл	3,27	423
121	F	F	O	циклопропіл	Me	H	5,6-дихлорпіридин-3-іл	3,11	407
122	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-метил-1-бензотіофен-2-іл	3,64	394
123	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-метил-1-бензотіофен-2-іл	3,74	410
124	F	F	S	циклопропіл	H	H	3-метил-1-бензотіофен-2-іл	4,31	410
125	F	F	O	H				3,39	358
126	Cl	F	O	H				3,57	374
127	Cl	F	O	циклопропіл	Me	H	2,5-дихлор-3-тієніл	4,24	428
128	F	F	O	циклопропіл	Me	H	2,5-дихлор-3-тієніл	4,03	412
129	Cl	F	O	метил	H	H	5-метил-3-феніл-1,2-оксазол-4-іл	2,59	395
130	F	F	O	метил	H	H	5-метил-3-феніл-1,2-оксазол-4-іл	2,44	379
131	F	F	O	циклопропіл	H	H	5-метил-2-феніл-2H-1,2,3-тріазол-4-іл	3,29	405
132	F	F	S	циклопропіл	H	H	5-метил-2-феніл-2H-1,2,3-тріазол-4-іл	4,04	421
133	F	F	O	метил	H	H	4-бром-3-тієніл	2,52	382
134	Cl	F	O	метил	H	H	4-бром-3-тієніл	2,70	398

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
135	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-бром-2-тієніл	3,11	408
136	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-бром-2-тієніл	3,29	424
137	F	F	O	циклопропіл	H	H	6-хлорхінолін-4-іл	2,44	409
138	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-хлорхінолін-4-іл	2,92	409
139	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2-хлорхінолін-4-іл	3,09	425
140	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-метил-4- (трифтор-метил)- 1,3-тіазол-5-іл	2,75	413
141	Cl	F	O	метил	H	H	3-хлор-1- бензотіофен-2-іл	3,63	404
142	F	F	O	метил	H	H	3-хлор-1- бензотіофен-2-іл	3,48	388
143	F	F	O	циклопропіл	H	H	5-хлор-1- бензотіофен-3-іл	3,73	414
144	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	5-хлор-1- бензотіофен-3-іл	3,83	430
145	F	F	S	циклопропіл	H	H	5-хлор-1- бензотіофен-3-іл	4,36	430
146	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2,5-диметил-1- феніл-1H-пірол-3- іл	3,94	433
147	F	F	O	циклопропіл	Me	H	2-метил-5-феніл- 3-тієніл	4,41	434
148	Cl	F	O	метил	H	H	4-метил-2-феніл- 1,3-тіазол-5-іл	2,90	411
149	F	F	O	метил	H	H	4-метил-2-феніл- 1,3-тіазол-5-іл	2,77	395
150	F	F	O	ізопропіл	H	H	1-(4-хлорфеніл)- 1H-піразол-4-іл	3,25	426
151	Cl	F	O	ізопропіл	H	H	1-(4-хлорфеніл)- 1H-піразол-4-іл	3,39	442
152	F	F	O	метил	H	H	3-(4-хлорфеніл)- 1,2-оксазол-5-іл	3,04	399
153	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-(4-хлорфеніл)- 1,2-оксазол-5-іл	3,46	425
154	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-(4-хлорфеніл)- 1,2-оксазол-5-іл	3,59	441

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
155	F	F	O	циклопропіл	H	H	1-феніл-1H-індол-2-іл	3,96	439
156	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	1-феніл-1H-індол-2-іл	4,13	455
157	F	F	O	метил	i-Pr	H	2-(метил-сульфаніл)-4-(трифтор-метил) піримідин-5-іл	3,46	456
158	Cl	F	O	метил	i-Pr	H	2-(метил-сульфаніл)-4-(трифтор-метил) піримідин-5-іл	3,59	472
159	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-(трифтор-метил) хінолін-4-іл	3,58	443
160	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2-(трифтор-метил) хінолін-4-іл	3,72	459
161	F	F	S	циклопропіл	H	H	2-(трифтор-метил) хінолін-4-іл	4,26	459
162	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	5,7-дихлор хінолін-4-іл	3,57	459
163	F	F	O	циклопропіл	H	H	5,7-дихлор хінолін-4-іл	3,39	443
164	F	F	O	метил	H	H	3-(3,4,5-трифтор феніл)-1,2-оксазол-5-іл	3,11	419
165	F	F	O	циклопропіл	H	H	3-(3,4,5-трифтор феніл)-1,2-оксазол-5-іл	3,53	445
166	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	3-(3,4,5-трифтор феніл)-1,2-оксазол-5-іл	3,64	461
167	F	F	O	циклопропіл	H	H	2-(4-хлорфеніл)-4-метил-1,3-тіазол-5-іл	3,85	455
168	Cl	F	O	циклопропіл	H	H	2-(4-хлорфеніл)-4-метил-1,3-тіазол-5-іл	4,01	471
169	F	F	O	циклопропіл	H	H	5-хлор-3-ізопропіл-1-феніл-1H-піразол-4-іл	3,94	466
170	F	F	O	циклопропіл	H	H	5-(дифтор-метокси)-1-метил-3-(трифтор метил)-	2,76	

Приклад	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	Маса (M+H)
							1H-піразол-4-іл		

Примітка ⁽¹⁾: Me: метил; i-Pr: ізопропіл

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

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

У колбу об'ємом 500 мл додали 6,0 г (31 ммоль) 5-хлор-3-(диформетил)-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)

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, 1 H); IR (TQ): 1759 і 1725 см⁻¹ (C=O).

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

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 °С. Одержану реакційну суміш збовтували при температурі 190-200 °С впродовж 22 годин. Дистильовання у вакуумі дало 8 г розчину (25 % молярних) 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).

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

До 400 мл ¹H водного розчину гідроксиду натрію додали краплями 67,5 г розчину (10 % молярного) 3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-¹H-піразол-4-карбонілфториду у тетрагідротіофен-1,1-діоксиді. Температуру підтримували нижче 20 °С 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-d₆) δ ч./млн: 3,90 (s, 3H); 7,22 (t, ¹H, J_{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: (M⁺-Cl) = 177 та (M⁺-F) = 193.

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

У пробірку Chemspeed об'ємом 13 мл відважили 0,27 ммоль фосфорного пентасульфід (P₂S₅). Додали 3 мл 0,18 молярного розчину аміду (I) (0,54 ммоль) в діоксані, і суміш нагрівали зі зворотним холодильником впродовж двох годин. Потім температуру охолодили до 80 °С, і додали 2,5 мл води. Суміш нагрівали до 80 °С 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 *Sphaerotherca fuliginea* (оріпки)

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 випробовування 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 відповідає ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця А:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
32	95	91	88	137	90
34	70	95	88	140	100
40	90	96	100	143	95
50	100	115	83	145	93
69	70	117	95	147	88
70	98	124	98	161	100
73	85	128	98	163	100
80	99	131	97	169	100
85	94	132	100	170	88

За таких самих умов спостерігали добрий (щонайменше 70 %) захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 69, тоді як не спостерігали будь-якого захисту зі сполукою із прикладу 186, розкритого в патентній заявці CN-1188764, як показано в таблиці А2.

Таблиця А2:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
69 з цього винаходу	500	70
186 з CN-1188764	500	0

Приклад 186, розкритий в міжнародній патентній заявці CN-1188764, відповідає 5-хлор-N-[(6-хлорпіридин-3-іл)метил]-1-метил-3-(трифторметил)-¹H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у CN-1188764.

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 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 *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 відповідає ефективності контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця В:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
5	80	90	95	124	100
10	100	91	95	125	94
28	90	93	100	127	95
32	70	94	95	128	100
37	80	95	95	131	90
39	95	96	95	132	90
40	95	98	80	133	70
42	70	100	95	137	80
48	95	103	94	138	95
49	80	104	94	140	80
50	95	105	95	142	80
67	95	106	95	143	95
70	100	108	90	145	90
71	95	109	95	147	95
73	90	111	95	149	80
75	70	114	95	153	90
81	100	115	100	155	95
82	100	116	90	157	70
83	94	117	100	165	100
85	80	118	95	167	90
86	70	120	90	169	100
88	78	121	95	170	95
89	80	122	95		

- За таких самих умов спостерігали відмінний захист (понад 95 %) при дозі 500 ч./млн. активного інгредієнта зі сполукою 138, тоді як не спостерігали будь-якого захисту із дез-фторовою сполукою-аналогом CMP1, заявленою у WO-2009/016221, як показано в таблиці В2.

Таблиця В2:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
138 з цього винаходу	500	95
CMP1 з WO-2009/016221	500	0

- Дез-фторова сполука-аналог CMP1, заявлена у WO-2008/016221 відповідає N-[(2-хлорхінолін-4-іл)метил]-N-циклопропіл-3-(дифторметил)-1-метил-¹H-піразол-4-карбоксаміду. Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2008/016221.
- За таких самих умов спостерігали відмінний (щонайменше 95 %) захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 71, тоді як не спостерігали будь-якого захисту зі сполукою з прикладу 28, розкритою у патентній заявці WO-2009/016222, як показано в таблиці В3.

Таблиця В3:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
71 з цього винаходу	500	95
28 з WO-2009/016222	500	0

- Приклад 28, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2009/016222, відповідає N-(1-бензофуран-2-ілметил)-N-циклопропіл-3-(дифторметил)-1-метил-¹H-піразол-4-карбоксаміду. Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/016222.
- За таких самих умов спостерігали повний захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 10, тоді як не спостерігали будь-якого захисту зі сполукою з прикладу 168, розкритого у патентній заявці CN-1188764, як показано в таблиці В4.

Таблиця В4:

Приклад	ч./млн	Ефективність
10 з цього винаходу	500	100
168 з CN-1188764	500	0

Приклад 168, розкритий у міжнародній патентній заявці CN-1188764, відповідає 5-хлор-N-(2-фурилметил)-1-метил-3-(трифторметил)-¹H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у CN-1188764.

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

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилформаміду

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 випробовування 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 відповідає ефективності контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця С:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
5	95	94	95	138	100
15	75	95	100	139	90
21	80	96	100	140	100
23	100	98	100	142	100
31	100	102	70	143	100
32	100	105	100	144	100
35	100	106	100	145	100
39	100	107	80	147	100
40	100	109	100	149	80
48	100	110	100	151	75
49	95	111	100	153	100
50	100	112	95	154	100
67	90	114	95	155	100
70	100	115	100	156	90
71	100	116	95	157	90
72	90	117	100	159	100
73	100	118	100	160	90
75	89	120	100	161	100
80	100	121	100	162	94
81	90	122	100	163	94
82	90	123	90	164	100
85	100	124	100	165	100
86	100	127	95	166	90
89	95	128	100	167	100
90	100	131	95	168	70
91	100	132	100	169	100
92	100	133	90	170	100
93	100	137	100		

Приклад D: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Venturia inaequalis* (парша яблук)

Розчинник: 24,5 частин за вагою ацетону

24,5 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполігліколюефіру

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 при вказаній нормі нанесення. Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини інокулювали водною суспензією конідій збудника захворювання парші яблук (*Venturia inaequalis*) і потім залишили на 1 день в інкубаторному ящику при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості 100 %.

Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 21 °C та відносній атмосферній вологості 90 %.

Випробування оцінювали через 10 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 відмінного (щонайменше 98 %) до повного захисту при дозі 100 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці D:

Таблиця D:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
70	100	91	100	132	98
80	100	95	99	147	100
85	100	128	100	169	99

За таких самих умов спостерігали відмінний захист (щонайменше 99 %) при дозі 10 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 85, тоді як слабкий захист (менше ніж 25 %) спостерігали зі сполукою з прикладу 17, розкритого у патентній заявці WO-2009/016222, як показано в таблиці D2.

Таблиця D2:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
85 з цього винаходу	10	99
17 з WO-2009/016222	10	21

Приклад 17, розкритий у міжнародній патентній заявці WO-2009/016222, відповідає N-[1-(1-бензо-тіофен-3-іл)етил]-N-циклопропіл-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/016222.

За тих самих умов спостерігали від відмінного (понад 95 %) до середнього (понад 50 %) захисту при дозі 100 ч./млн та 10 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 169, тоді як від середнього (менше ніж 60 %) до дуже слабкого (менше ніж 5 %) захисту спостерігали із дезфторовою сполукою-аналогом CMP2, заявленою WO-2008/015189, як показано у таблиці D3.

Таблиця D3:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
169 з цього винаходу	100	99
	10	56
CMP2 з WO-2008/015189	100	53
	10	4

Дез-фторова сполука-аналог CMP2, заявлена у WO-2008/015189, відповідає N-[(5-хлор-3-ізопропіл-1-феніл-¹H-піразол-4-іл)метил]-N-циклопропіл-3-(дифторметил)-1-метил-¹H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2008/015189.

Приклад E: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Septoria 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 *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 %.

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 відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця E:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
40	100	85	90	122	100
48	100	90	100	128	90
50	71	91	100	143	100
70	100	93	100	147	80
71	100	95	80	155	100
80	100	115	86	169	100

Приклад F: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Blumeria graminis* (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 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*.

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

5 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.

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

10

Таблиця F:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
40	100	85	100	143	94
48	100	90	100	147	70
50	89	91	94	155	70
70	80	93	94	169	100
71	89	95	100		
80	86	128	100		

Приклад G: Захисне випробування в умовах *in vivo* на *Fusarium nivale* (пшениця)

15

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполігліколяефіру

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.

20

Для випробування захисної активності молоді рослини трохи пошкодили із застосуванням піскоструминного апарату і після цього оприскали суспензією конідій *Fusarium nivale* (вар. *maius*) та помістили на 24 години в теплицю у напівпрозорий інкубаторний ящик при температурі приблизно 10 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 100 %, а згодом оприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення.

25

Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини залишили у теплиці під напівпрозорим інкубаторним ковпаком при температурі приблизно 10 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 100 %.

Випробування оцінювали через 5 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

30

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

Таблиця G:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
40	92	90	100	128	100
48	86	91	71	147	92
70	100	93	71	155	100
71	100	95	86	169	83
80	93	115	71		
85	100	122	93		

35

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

Розчинник: 49 частин за вагою N, N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполігліколяефіру

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 випробовування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Через день після цієї обробки рослини інокулювали водною суспензією спор *Leptosphaeria podorum*. 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 відповідає ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця Н:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
48	100	85	100	128	100
50	71	90	100	147	93
70	83	91	100	155	80
71	80	115	80	169	100
80	100	122	100		

Приклад І: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Uromyces appendiculatus* (боби)

Розчинник: 24,5 частин за вагою ацетону

24,5 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 випробовування профілактичної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, рослини інокулювали водною суспензією спор збудника захворювання іржі бобових (*Uromyces appendiculatus*), а потім залишили на 1 день в інкубаторному ящику при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості 100 %.

Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 21 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 90 %.

Випробування оцінювали через 10 днів після інокулювання. 0 % означало ефективність, що відповідає ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від високого (щонайменше 80 %) до повного захисту при дозі 100 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці І:

Таблиця І:

Приклад	Ефективність
70	100
95	90
128	100
147	83
169	100

Таблиця J: Захисне випробування в умовах in vivo на *Puccinia triticina* (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 захисної 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 triticipina*. Рослини залишили на 48 годин в інкубаторному ящику при температурі приблизно 20 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 100 %.

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 відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

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

Таблиця J:

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
40	71	91	100	128	100
80	100	93	100	155	75
85	100	95	83	169	100
90	88	122	100		

За таких самих умов спостерігали повний захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта зі сполукою 85, тоді як слабкий захист (менше ніж 25 %) спостерігали зі сполукою з прикладу 17, розкритого в патентній заявці WO-2009/016222, як показано в таблиці J2.

Таблиця J2:

Приклад	доза (ч./млн)	Ефективність
85 з цього винаходу	500	100
17 з WO-2009/016222	500	20

Приклад 17, розкритий в міжнародній патентній заявці WO-2009/016222, відповідає N-[1-(1-бензо-тіофен-3-іл)етил]-N-циклопропіл-3-(дифторметил)-1-метил-¹H-піразол-4-карбоксаміду.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближчі до них сполуки, розкриті у WO-2009/016222.

Приклад K: Захисне випробування в умовах *in vivo* на *Botrytis cinerea* (боби)

Розчинник: 24,5 частин за вагою ацетону

24,5 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 випробовування захисної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки. Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, 2 маленькі шматочки агару, покриті культурами *Botrytis cinerea*, поклали на кожний лист. Інокульовані рослини помістили в затемнену камеру при температурі 20 °C та відносній атмосферній вологості 100 %.

Через 2 дні після інокулювання оцінювали розмір уражень на листях. 0 % означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100 % ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

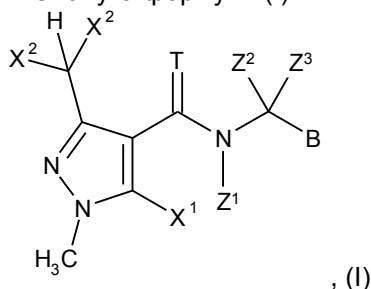
За цих умов спостерігали від відмінного (щонайменше 95 %) до повного захисту при дозі 100 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці K:

Таблиця К:

Приклад	Ефективність
70	95
80	100
128	100
147	100
169	100

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука формули (I)



де

T означає O або S;

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

10 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 C₃-C₇-циклоалкіл; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений 3-оксетаніл; або заміщений чи незаміщений 3-тіетаніл;

15 Z² та 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 галогену; 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-C₁-C₈-алкілкарбамоїл; або заміщений чи незаміщений N-C₁-C₈-алкіл-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; або

25 Z² та Z³ разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють заміщений або незаміщений C₃-C₇ циклоалкіл; або

30 Z³ та замісник X, сусідній до точки прикріплення B-групи, разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати заміщений або незаміщений 5-, 6- або 7-членний, частково насичений, карбо- або гетероцикл, що містить до 3-х гетероатомів, а Z² має описане тут значення;

35 B означає насичене, частково насичене або ненасичене, моноциклічне або конденсоване біциклічне 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 10-членне кільце, що містить від 1 до 4 гетероатомів, вибраних з переліку, що складається з N, O, S, які можуть бути заміщені до 6 групами X, які можуть бути однаковими або різними; за умови, що B не означає 2-піридинське кільце, а також B не означає незаміщене чи заміщене 1,3-бензодіоксолільне кільце, коли Z¹ означає заміщену або незаміщену циклопропільну групу;

40 X означає атом галогену; нітро; ціано; ізонітрил; гідрокси; аміно; сульфаніл; пентафтор-λ⁶-сульфаніл; форміл; формілокси; форміламіно; заміщений або незаміщений (гідроксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₁-C₈-алкоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₂-C₈-алкенілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₂-C₈-алкінілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (бензилоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; карбокси; карбамоїл; N-

- гідрокси карбамоїл; карбамат; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкеніл; C_2 - C_8 -галогеналкеніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкініл; C_2 - C_8 -галогеналкініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси; C_1 - C_8 -галогеналкокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфаніл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфініл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфоніл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламіно; заміщений або незаміщений C_2 - C_8 -алкенілокси; C_2 - C_8 -галогеналкенілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_3 - C_8 -алкінілокси; C_2 - C_8 -галогеналкінілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл; C_3 - C_7 -галогенциклоалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений $(C_3$ - C_7 -циклоалкіл)- C_1 - 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 три(C_1 - C_8)алкілсиліл; заміщений або незаміщений три(C_1 - C_8)алкілсиліл- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл карбоніл; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбонілокси; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбоніламіно; C_1 - C_8 -галогеналкілкарбоніламін, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксикарбоніл; C_1 - C_8 -галогеналкоксикарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілоксикарбонілокси; C_1 - C_8 -галогеналкоксикарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіламінкарбонілокси; заміщений або незаміщений ді- C_1 - C_8 -алкіламінкарбонілокси; заміщений або незаміщений N-(C_1 - C_8 -алкіл)гідроксикарбамоїл; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкоксикарбамоїл; заміщений або незаміщений N-(C_1 - C_8 -алкіл)- C_1 - C_8 -алкоксикарбамоїл; арил який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C_1 - C_8 -арилалкіл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C_2 - C_8 -арилалкеніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C_2 - C_8 -арилалкініл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилокси, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилсульфаніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; ариламін, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C_1 - C_8 -арилалкілокси, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C_1 - C_8 -арилалкілсульфаніл, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або C_1 - C_8 -арилалкіламін, який може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або два замісники X разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати 5- або 6-членний насичений карбоцикл, який може бути заміщений до чотирма групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або Z^3 та замісник X, сусідній до точки прикріплення B-групи, разом з послідовними атомами вуглецю, до яких вони прикріплені, можуть утворювати 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;
- Q незалежно означає атом галогену; ціано; нітро; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкіл; C_1 - C_8 -галогеналкіл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкокси; C_1 - C_8 -галогеналкокси, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C_1 - C_8 -алкілсульфаніл; C_1 - C_8 -галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений три(C_1 - C_8)алкілсиліл; заміщений або незаміщений три(C_1 - C_8)алкілсиліл- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений (C_1 - C_8 -алкоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл; заміщений або незаміщений (бензилоксііміно)- C_1 - C_8 -алкіл;
- а також її солі, N-оксиди, металеві комплекси, металоїдні комплекси та оптично-активні або геометричні ізомери.
2. Сполука за п. 1, в якій Z^1 означає незаміщений циклопропіл, атом водню, метил або етил.
3. Сполука за п. 1 або п. 2, в якій T означає O.
4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, в якій X^1 означає атом фтору.
5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, в якій X^2 означає атом фтору.

6. Сполука за будь-яким із пп. 1-5, в якій Z^2 та Z^3 незалежно означають атом водню або метил.
7. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, в якій Z^2 означає атом водню, а Z^3 означає атом водню або метил.
8. Сполука за будь-яким із пп. 1-7, в якій В означає заміщене або незаміщене тієнільне кільце,
5 заміщене або незаміщене бензотієнільне кільце, заміщене або незаміщене хінолінільне кільце,
заміщене або незаміщене ізохінолінільне кільце або заміщене чи незаміщене бензофуранове
кільце.
9. Сполука за будь-яким із пп. 1-8, в якій В означає заміщене або незаміщене тієнільне кільце.
10. Сполука за будь-яким із пп. 1-8, в якій В означає заміщене або незаміщене бензотієнільне
10 кільце.
11. Сполука за будь-яким із пп. 1-10, в якій Х незалежно означає 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_1 - C_8 -алкокси або C_1 - C_8 -галогеналкокси,
що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.
12. Фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки
15 формули (I) за будь-яким із пп. 1-11 та прийнятні для сільського господарства підкладку, носій
або наповнювач.
13. Спосіб боротьби із фітопатогенними грибами культур рослин, який **відрізняється** тим, що
агрономічно ефективну і по суті нефітотоксичну кількість сполуки за будь-яким із пп. 1-11 або
20 фунгіцидної композиції за п. 12 наносять на ґрунт, де ростуть рослини або де вони можуть
рости, на листя та/або плоди рослин або на насіння рослин.

Комп'ютерна верстка І. Скворцова

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

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