



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201657 T1



HR P20201657 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A01N 43/42 (2006.01)
C07D 215/54 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 25.12.2020.

(21) Broj predmeta: P20201657T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 14.10.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2017055273
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.03.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17709075.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.03.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017153380
Datum međunarodne objave: 14.09.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3426032 A1
Datum objave europske prijave patenta: 16.01.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3426032 B1
Datum objave europskog patenta: 05.08.2020.

(31) Broj prve prijave: 16159707
17154212

(32) Datum podnošenja prve prijave: 10.03.2016.
01.02.2017.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP
EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Syngenta Participations AG, Rosentalstrasse 67, 4058 Basel, CH
Matthias Weiss, Syngenta Crop Protection AG, Schaffhauserstrasse,
4332 Stein, CH
Farhan Bou Hamdan, Syngenta Crop Protection AG,
Schaffhauserstrasse, 4332 Stein, CH
Laura Quaranta, Syngenta Crop Protection AG, Schaffhauserstrasse,
4332 Stein, CH

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

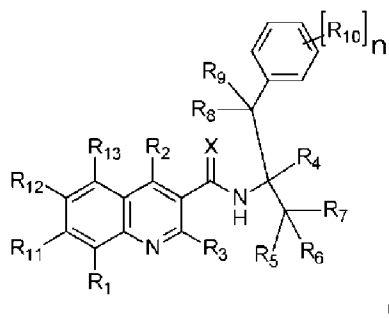
(54) Naziv izuma:

MIKROBIOCIDNI DERIVATI KINOLIN (TIO)KARBOKSAMIDA

HR P20201657 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj s formulom (I):



5 naznačen time što

X je O ili S;

R₁ je vodik, halogen, metil, metoksi ili cijano;

R₂ i R₃ su svaki neovisno vodik, halogen ili metil;

10 R₄ je vodik, cijano, C₁-C₄ alkil, ili C₃-C₄ cikloalkil, pri čemu alkil i cikloalkil, mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine halogen, cijano, C₁-C₃ alkil, C₁-C₃ alkoksi i C₁-C₃ alkiltio;

R₅ i R₆ su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, halogen, C₁-C₄ alkil, C₁-C₄ alkoksi i C₁-C₄ alkiltio; ili

15 R₅ i R₆ zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju C=O, C=NOR_c, C₃-C₅ cikloalkil ili C₂-C₅ alkenil, pri čemu cikloalkil i alkenil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine halogen, cijano, C₁-C₃ alkil, C₁-C₃ alkoksi i C₁-C₃ alkiltio;

R₇ je vodik, C₁-C₅ alkil, C₃-C₅ cikloalkil, C₂-C₅ alkenil, C₃-C₅ cikloalkenil, ili C₂-C₅ alkinil, pri čemu alkil, cikloalkil, alkenil, alkinil, cikloalkenil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 4 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine halogen, cijano, C₁-C₃ alkil, C₁-C₃ alkoksi, hidroksil i C₁-C₃ alkiltio;

20 R₈ i R₉ su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, halogen, C₁-C₄ alkil i C₁-C₄ alkoksi; ili

R₈ i R₉ zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju C₃-C₅ cikloalkil, pri čemu cikloalkil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine halogen, cijano, C₁-C₃ alkil, C₁-C₃ alkoksi i C₁-C₃ alkiltio;

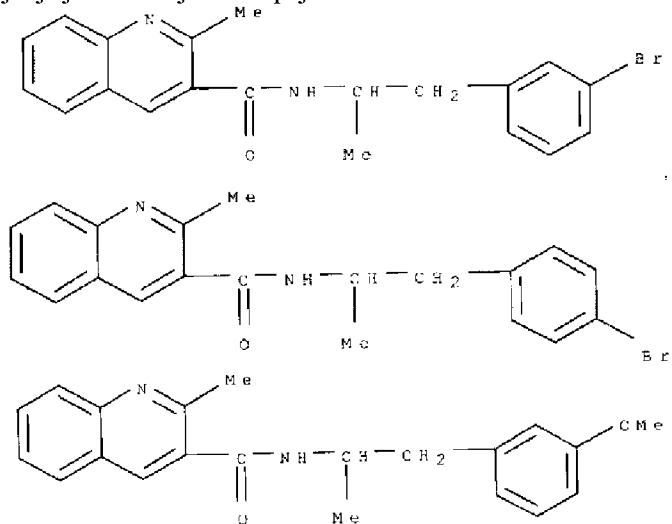
25 svaki R₁₀ neovisno predstavlja halogen, nitro, cijano, formil, C₁-C₅ alkil, C₂-C₅ alkenil, C₂-C₅ alkinil, C₃-C₆ cikloalkil, C₁-C₅ alkoksi, C₃-C₅ alkeniloksi, C₃-C₅ alkiniloksi, C₁-C₅ alkiltio, -C(=NOR_c)C₁-C₅ alkil, ili C₁-C₅ alkilkarbonil, pri čemu alkil, cikloalkil, alkenil, alkinil, alkoksi, alkeniloksi, alkiniloksi i alkiltio mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 5 supstituenta neovisno odabranih iz niza koji čine halogen, C₁-C₃ alkil, C₁-C₃ alkoksi, cijano i C₁-C₃ alkiltio; n je 0, 1, 2, 3, 4 ili 5;

30 svaki R_c je neovisno odabran iz niza koji čine vodik, C₁-C₄ alkil, C₂-C₄ alkenil, C₃-C₄ alkinil, C₃-C₄ cikloalkil(C₁-C₂)alkil i C₃-C₄ cikloalkil, pri čemu alkil, cikloalkil, alkenil i alkinil skupine mogu biti po izboru supstituirane sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine halogen i cijano;

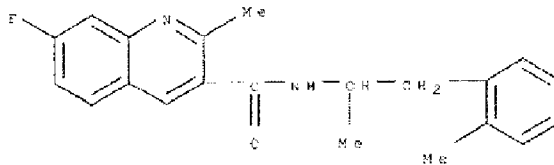
R₁₁ je vodik, halogen, metil, metoksi ili cijano;

R₁₂ i R₁₃ su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, halogen, metil, metoksi ili hidroksil; i njihove soli i/ili N-oksidi;

35 pod uvjetom da spoj nije jedan od sljedećih spojeva:



ili



2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 naznačen time što R_1 je vodik, fluoro, kloro, metil, ili cijano.
3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 ili 2 naznačen time što R_2 i R_3 su svaki neovisno vodik ili metil.
- 5 4. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2 ili 3 naznačen time što R_4 je vodik, cijano, C_1 - C_3 alkil, ili ciklopropil, pri čemu alkil i cikloalkil, mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, cijano, metil, metoksi i metiltio.
5. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3 ili 4 naznačen time što su R_5 i R_6 svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, C_1 - C_2 alkil, C_1 - C_2 alkoksi i C_1 - C_2 alkiltio; ili R_5 i R_6 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju $C=O$ ili ciklopropil, pri čemu ciklopropil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 2 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, metil i cijano.
- 10 6. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3, 4, ili 5 naznačen time što R_7 je C_1 - C_4 alkil, C_3 - C_4 cikloalkil, C_2 - C_4 alkenil, ili C_2 - C_3 alkinil, pri čemu alkil, cikloalkil, alkenil, alkinil, mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, cijano, metil, hidroksil i metiltio.
- 15 7. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3, 4, 5 ili 6 naznačen time što R_8 i R_9 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, C_1 - C_2 alkil i C_1 - C_2 alkoksi; ili R_8 i R_9 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju ciklopropil, pri čemu ciklopropil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 2 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, cijano, i metil.
8. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3, 4, 5, 6 ili 7 naznačen time što svaki R_{10} neovisno predstavlja halogen, cijano, C_1 - C_3 alkil, C_2 - C_3 alkenil, C_2 - C_3 alkinil, ciklopropil, metoksi, aliloksi, propargiloksi, ili C_1 - C_2 alkiltio, pri čemu alkil, ciklopropil, alkenil, alkinil, metoksi, aliloksi, propargiloksi i alkiltio mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, metil, i cijano; n je 0, 1, 2 ili 3.
- 20 9. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 ili 8 naznačen time što R_{11} je vodik, fluoro, kloro, metil ili cijano; i R_{12} i R_{13} su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, metil i hidroksil.
- 25 10. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 naznačen time što X je O ili S; R_1 je vodik, fluoro, kloro, metil, ili cijano; R_2 i R_3 su svaki neovisno vodik ili metil; R_4 je vodik, cijano, C_1 - C_3 alkil, ili ciklopropil, pri čemu alkil i cikloalkil, mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, cijano, metil, metoksi, i metiltio; R_5 i R_6 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, C_1 - C_2 alkil, C_1 - C_2 alkoksi i C_1 - C_2 alkiltio; ili R_5 i R_6 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju $C=O$ ili ciklopropil, pri čemu ciklopropil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 2 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, metil i cijano; R_7 je C_1 - C_4 alkil, C_3 - C_4 cikloalkil, C_2 - C_4 alkenil, ili C_2 - C_3 alkinil, pri čemu alkil, cikloalkil, alkenil, alkinil, mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, cijano, metil, hidroksil i metiltio; R_8 i R_9 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, C_1 - C_2 alkil i C_1 - C_2 alkoksi; ili R_8 i R_9 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju ciklopropil, pri čemu ciklopropil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 2 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, cijano, i metil; svaki R_{10} neovisno predstavlja halogen, cijano, C_1 - C_3 alkil, C_2 - C_3 alkenil, C_2 - C_3 alkinil, ciklopropil, metoksi, aliloksi, propargiloksi, ili C_1 - C_2 alkiltio, pri čemu alkil, ciklopropil, alkenil, alkinil, metoksi, aliloksi, propargiloksi i alkiltio mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, metil, i cijano; n je 0, 1, 2 ili 3; R_{11} je vodik, fluoro, kloro, metil ili cijano; i R_{12} i R_{13} su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, metil i hidroksil; ili njegova sol ili N-oksid.
- 30 40 11. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 naznačen time što X je O ili S; R_1 je vodik, fluoro, metil, ili cijano; R_2 je vodik i R_3 je vodik ili metil; ili R_2 je vodik ili metil i R_3 je vodik; R_4 je vodik, cijano, metil ili etil, pri čemu metil i etil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro i metoksi; R_5 i R_6 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro, metil, metoksi i metiltio; ili R_5 i R_6 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju ciklopropil; R_7 je C_1 - C_4 alkil, C_3 - C_4 cikloalkil, ili C_2 - C_4 alkenil, pri čemu alkil, cikloalkil i alkenil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro, hidroksil, cijano i metil; R_8 i R_9 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro i metil; ili R_8 i R_9 zajedno s atomom ugljika na koji su oni vezani predstavljaju ciklopropil; svaki R_{10} neovisno predstavlja fluoro, kloro, cijano, metil, ciklopropil, metoksi ili metiltio, pri čemu metil, ciklopropil, metoksi i metiltio mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro i kloro; n je 0, 1 ili 2; R_{11} je vodik, fluoro, metil ili kloro; i R_{12} i R_{13} su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik, fluoro i metil; ili njegova sol ili N-oksid.
- 50 55 12. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 naznačen time što X je O ili S; R_1 je vodik ili fluoro; R_2 i R_3 su oba vodik; R_4 je metil ili etil (pri čemu metil i etil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 fluoro supstituenta); R_5 i R_6 su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik i fluoro; R_7 je metil, etil, n-propil, izo-propil, sec-butil, tert-butil, C_3 - C_4 cikloalkil, ili C_2 - C_4 alkenil, pri čemu metil, etil, n-propil, izo-propil, sec-butil, tert-butil, cikloalkil i alkenil mogu biti po izboru supstituirani sa 1 do 3 supstituenta neovisno odabrana iz niza koji čine fluoro, kloro i metil; R_8 i R_9

su svaki neovisno odabrani iz niza koji sadrži vodik ili fluoro; svaki R_{10} neovisno predstavlja fluoro, kloro, cijano ili metil, pri čemu metil može biti po izboru supstituiran sa 1 do 3 fluoro supstituenta; n je 0, 1 ili 2; i R_{11} je vodik ili fluoro; R_{12} i R_{13} su oba vodik; ili njegova sol ili N-oksidi.

13. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 ili 12 naznačen time što X je O.

5 14. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 naznačen time što je odabran od:

N-[1-benzil-1-metil-2-(1-metilciklopropil)etil]-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-47),
 N-(1-benzil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil)-8-metil-kinolin-3-karboksamida (spoj E-61),
 N-(1-benzil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil)-8-kloro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-60),
 N-(1-benzil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-39),
 10 N-(1-benzil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil)-7,8-difluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-102),
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-butil)-7,8-difluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-48),
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-but-3-enil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-35),
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-but-3-enil)-7,8-difluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-55),
 8-fluoro-N-[1-[(3-fluorofenil)metil]-1,3-dimetil-butil]kinolin-3-karboksamida (spoj E-26),
 15 8-fluoro-N-[3,3,3-trifluoro-1-[(3-fluorofenil)metil]-1-metil-propil]kinolin-3-karboksamida (spoj E-99),
 N-(1-benzil-3,3-difluoro-1-metil-butil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-50),
 N-(1-benzil-3-fluoro-1,3-dimetil-butil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-56),
 N-(1-benzil-1,3,3-trimetil-butil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-34),
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-butil)-8-fluoro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-6),
 20 N-(1-benzil-1,3-dimetil-butil)-8-metil-kinolin-3-karboksamida (spoj E-20),
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-butil)-8-kloro-kinolin-3-karboksamida (spoj E-14) i
 N-(1-benzil-1,3-dimetil-butil)kinolin-3-karboksamida (spoj E-13).

15. Pripravak naznačen time što sadrži fungicidno učinkovitu količinu spoja s formulom (I) kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 - 13.

25 16. Pripravak prema patentnom zahtjevu 15, naznačen time što pripravak nadalje sadrži barem jedan dodatni aktivni sastojak i/ili razrjeđivač.

17. Postupak borbe protiv, sprječavanja ili suzbijanja fitopatogenih bolesti koji uključuje primjenu na fitopatogen, na lokus fitopatogena, ili na biljku osjetljivu na napad fitopatogena, ili na njihov materijal za razmnožavanje, fungicidno učinkovite količine spoja s formulom (I) kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 - 13 ili priprema
 30 koji sadrži fungicidno učinkovitu količinu spoja formule (I) kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 - 13.