

(19) C2 (11) 97533 (13) UA

(98) Юридика і патентна фірма "Грищенко та Партнери", вул. Артема, 37-41 (3-й пов.), м. Київ, 0405

(85) 2010-02-28

(74) Льгова Майя Миколаївна, (UA)

(45) [2012-02-27]

(43) [2010-04-12]

(24) 2012-02-27

(22) 2008-07-31

(12) Патент України (на 20 р.)

(21) a201000816

(46) 2021-10-20

(86) 2008-07-31 PCT/EP2008/060039

(30) 07356104.5 2007-07-31 EP

(54) АМІДИНОВІ ПОХІДНІ N-ЦИКЛОАЛКИЛБЕНЗИЛУ, ФУНГІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЇХ ОСНОВІ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ
З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ КУЛЬТУР АМИДИНОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ N-ЦИКЛОАЛКИЛБЕНЗИЛА, ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ
НА ИХ ОСНОВЕ И СПОСОБ БОРЬБЫ С ФИТОПАТОГЕННЫМИ ГРИБАМИ КУЛЬТУР N-CYCLOALKYL-BENZYL AMIDE DERIVATIVE
S, FUNGICIDE COMPOSITION BASED THEREON AND METHOD FOR THE CONTROL OF PHYTOPATHOGENIC FUNGI

(56) WO 2006120224, A, 16.11.2006 2

(71) DE БАЙЕР КРОПСАЙНС АГ DE БАЙЕР КРОПСАЙНС АГ DE BAYER CROPSCIENCE AG

(72) FR Деборде Філіп FR Деборде Филип FR Desbordes, Philippe FR Гари Стефан FR Гари Стефан FR Gary, Stephan

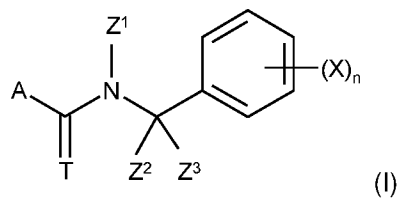
ie FR Гросжан-Курноер Марі-Клер FR Гросжан-Курноер Мари-Клер FR Grosjean-Courmoyer Marie-Claire FR Хартманн Бе

нуа FR Хартманн Бенуа FR Hartmann, Benoit FR Рінольфі Філіп FR Ринольфи Филип FR Rinolfi, Philippe FR Ворс Жан

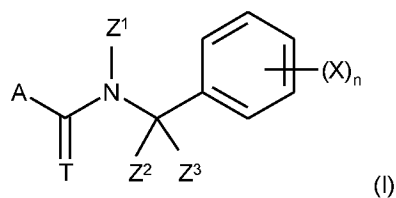
-П'єр FR Ворс Жан-П'єр FR Vors, Jean-Pierre

(73) DE Байер Інтелекчуал Проперті ГмбХ

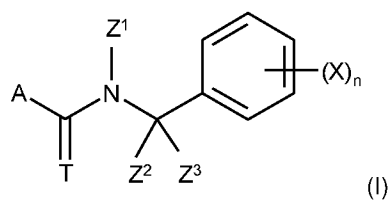
Амидиновые производные N-циклоалкилбензила формулы (I), где А означает связанный углеродом, ненасыщенный или частично насыщенный 5-членный гетероциклил, в которой выбирают из А¹, А², А³, А⁶, А⁷, А¹², А¹³, А¹⁴, А²³, А²⁴, А²⁵; Т означает S; Z¹ означает С₃-С₇-циклоалкил и Z², Z³, X означают разными заместители, n означает 1-5; фунгицидная композиция на их основе и способ борьбы с фитопатогенными грибами.



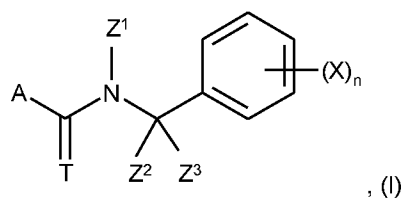
Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу формули (I), де А означає зв'язаний вуглецем, ненасичений або частково насичений 5-членний гетероциклі, в якій вибирають з А¹, А², А³, А⁶, А⁷, А¹², А¹³, А¹⁴, А²³, А²⁴, А²⁵; Т означає S; Z¹ означає С₃-С₇-циклоалкіл та Z², Z³, Х означають різними замісники, n означає 1-5; фунгіцидна композиція на їх основі та спосіб боротьби з фітопатогенними грибами.



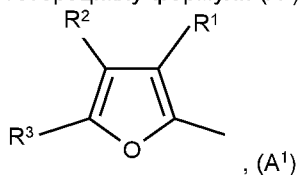
The present invention relates to N-cycloalkyl-benzyl-thiocarbox-amide or N-cycloalkyl-benzyl-N-substituted-carboximidamide amide derivatives of formula (I) wherein A represents a carbo-linked, unsaturated or partially saturated, 5-membered heterocyclyl; T represents S; Z¹ represents a C₃-C₇-cycloalkyl and Z²; Z³, X and n represent various substituents; their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.



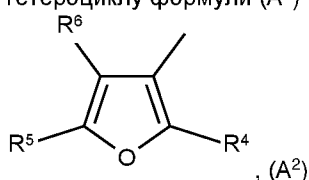
1. Амідинові похідні N-циклоалкілбензили формули (I)



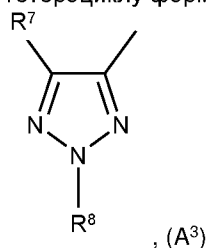
в якій А вибирають з:
гетероциклу формули (A¹)



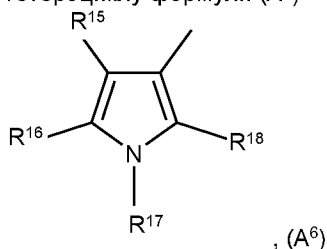
в якій
R¹-R³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
гетероциклу формули (A²)



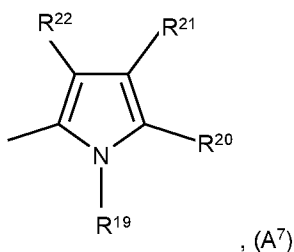
в якій
R⁴-R⁶, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
гетероциклу формули (A³)



в якій
R⁷ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R⁸ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;
гетероциклу формули (A⁶)



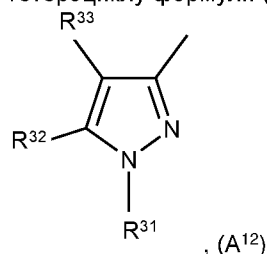
в якій
R¹⁵ означає атом водню; атом галогену; ціано; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
R¹⁶ і R¹⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;
R¹⁷ означають атом водню або C₁-C₅-алкіл;
гетероциклу формули (A⁷)



в якій

R¹⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

R²⁰-R²², які можуть бути однаковими або різними, означають атом галогену; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; гетероциклу формули (A¹²)



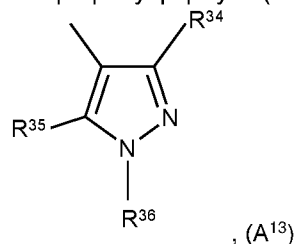
в якій

R³¹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

R³² означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³³ означає атом водню; атом галогену; нітро; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

гетероциклу формули (A¹³)



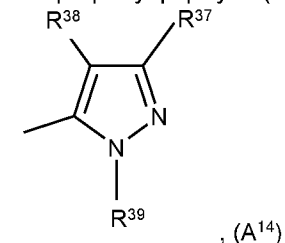
в якій

R³⁴ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₃-C₅-циклоалкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкінілокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³⁵ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; ціано; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₆-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; C₁-C₅-алкіламіно або ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

R³⁶ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

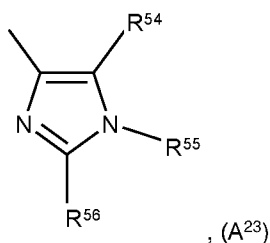
гетероциклу формули (A¹⁴)



в якій

R³⁷ і R³⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-алкілсульфаніл; R³⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

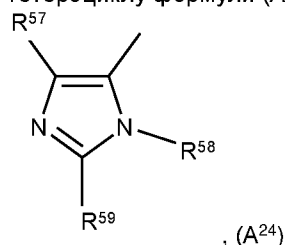
гетероциклу формули (A²³)



в якій

R⁵⁴ і R⁵⁶, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R⁵⁵ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

гетероциклу формули (A²⁴)

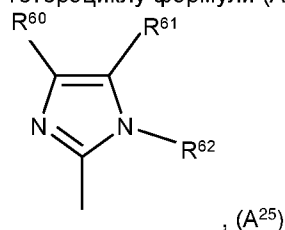


в якій

R⁵⁷ і R⁵⁹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁵⁸ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

гетероциклу формули (A²⁵)



в якій

R⁶⁰ і R⁶¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁶² означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

T означає S;

Z¹ означає незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл або C₃-C₇-циклоалкіл, заміщений до 10 атомами або групами, які можуть бути однаковими або різними і які можуть бути вибрані з переліку, що складається з атомів галогену; C₁-C₈-алкілу; C₁-C₈-галогеноалкілу, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

Z² і Z³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; C₁-C₈-алкіл; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-алкініл; атом галогену; C₁-C₈-алкокси; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-алкінілокси; C₃-C₇-циклоалкіл;

X, які можуть бути однаковими або різними, означають атом галогену; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкіл; C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; C₃-C₇-галогеноциклоалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; три(C₁-C₈-алкіл)силіл; три(C₁-C₈-алкіл)силіл-C₁-C₈-алкіл; бензилокси, який може бути заміщений до 5 групами Q; фенокси, який може бути заміщений до 5 групами Q; феніл, який може бути заміщений до 5 групами Q; піридиніл, який може бути заміщений до чотирма групами Q, і піридинілокси, який може бути заміщений до чотирма групами Q;

два замісника X разом з наступними атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, можуть утворювати 5- або 6-членний, насичений, карбо- або гетероцикл, який може бути заміщений до чотирма групами Q, що можуть бути однаковими або різними;

n означає 1, 2, 3, 4 або 5;

Q, які можуть бути однаковим або різним, означає атом галогену; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; три(C₁-C₈) алкілсиліл і три(C₁-C₈)алкілсиліл-C₁-C₈-алкіл; а також її солі.

2. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за п. 1, де A вибирають з переліку, що складається з A², A³, A⁶ і A¹³.

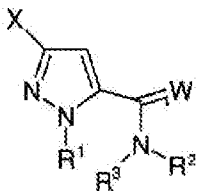
3. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за п. 2, де A означає A¹³.

4. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за пп. 1-3, де Z¹ означає C₃-C₇ циклоалкіл, заміщений до 10 групами або атомами, які можуть бути однаковими або різними і які можуть бути вибрані з переліку, що складається з атомів галогену; C₁-C₈-алкілу; C₁-C₈-галогеноалкілу, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси або C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними.

5. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за пп. 1-3, де Z¹ означає незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл.
6. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за п. 5, де Z¹ означає циклопропіл.
7. Амідинові похідні N-циклоалкілбензилу за пп. 1-6, де X може бути однаковим або різним, означає атом галогену, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, три(C₁-C₈-алкіл)силіл, C₁-C₈-алкокси або C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або в якій два послідовні замісники X разом з фенільним кільцем утворюють заміщений або незаміщений 1,3-бензодіоксоліл, 1,2,3,4-тетрагідро-хіноксалініл, 3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазиніл, 1,4-бензодіоксаніл, інданіл; 2,3-дигідробензофураніл, індолініл.
8. Фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки формули (I) за пп. 1-7 та придатні для сільського господарства основу, носій або наповнювач.
9. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами культур, який **відрізняється** тим, що вносять в ґрунт, де рослини ростуть або здатні рости, на листя та/або плоди рослин або на насіння рослин агрономічно ефективну та по суті нефітотоксичну кількість сполуки за пп. 1-7 або композиції за п. 8.

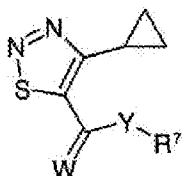
Даний винахід належить до амідних похідних N-циклоалкіл-бензил-тіокарбоксаміду або N-циклоалкіл-бензил-N-заміщеного карбоксимідаміду, способу їх одержання, їхнього застосування як фунгіцидно активних агентів, переважно у вигляді фунгіцидної композиції, та способу боротьби з фітопатогенними грибами, в основному рослин, за допомогою цих сполук або композицій.

В міжнародній заявці на патент WO-96/38419 описані певні 2-піридил-метилен-тіокарбоксамідні похідні в загальному широкому відображенні великої кількості сполук наступної формули:



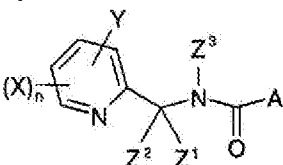
де X означає галоген, W може означати атом сірки, R¹ може означати C₁-C₄-алкіл, R² може означати C₃-C₇-циклоалкіл та R³ може означати різними замісники, зокрема феніл. Однак, цей документ не описує конкретно та не пропонує, як вибрати такі сполуки, де атом азоту тіокарбоксамідного залишку може бути заміщений циклоалкілом.

В міжнародній заявці на патент WO-06/098128 описані певні 2-піридил-метилен-тіокарбоксамідні похідні в загальному широкому відображенні великої кількості сполук наступної формули:



де W може означати атом сірки, Y може означати N-циклоалкіл та R⁷ може означати різними замісники, зокрема феніл. Однак, цей документ не описує конкретно та не пропонує, як вибрати такі сполуки, де атом азоту тіокарбоксамідного залишку може бути заміщений циклоалкілом.

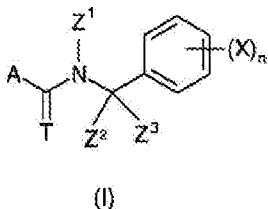
Міжнародна заявка на патент WO-06/120224 описує 2-піридил-метилен-тіокарбоксамідні похідні наступної формули:



однак цей документ не містить жодного натяку, як одержати фунгіцидні N-бензил-(тіокарбоксамідні або карбоксимідамідні) похідні згідно з винаходом.

В сільському господарстві завжди викликало інтерес застосування нових пестицидних сполук для можливості запобігання або боротьби зі стійкими до активних сполук штамами. Також цікавило застосування сполук більш активних, ніж вже відомі, маючи за мету зменшення кількості використовуваних сполук при одночасному зберіганні ефективності, принаймні еквівалентної відомим сполукам. В даній заявці ми пропонуємо новий клас сполук, який має вищезазначену дію та переваги.

Таким чином, даний винахід стосується N-циклоалкіл-бензил-тіокарбоксамідних або N-циклоалкіл-бензил-N-заміщених карбоксимідамідних похідних формули (I)



де

- A означає зв'язану вуглецем ненасичену або частково насичену 5-членну гетероциклічну групу, яка може бути заміщена до чотирьох груп R;

- T означає S, N-R^a, N-OR^a, N-NR^aR^b або N-CN;

- Z¹ означає незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл або C₃-C₇-циклоалкіл, заміщений до 10 атомів або груп, які можуть бути однаковими або різними і які можуть бути вибрані з переліку, що включає атоми галогену; ціано; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-галогеноалкоксикарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламінокарбоніл; ді-C₁-C₈-алкіламінокарбоніл;

- Z² та Z³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; C₁-C₈-алкіл; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-алкініл; ціано; нітро; атом галогену; C₁-C₈-алкокси; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-алкінілокси; C₃-C₇-циклоалкіл; C₁-C₈-алкілсульфеніл; аміно; C₁-C₈-алкіламіно; ді-C₁-C₈-алкіламіно; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-алкілкарбамоїл; ді-C₁-C₈-алкілкарбамоїл; N-C₁-C₈-алкіл-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; або

- Z² та Z³, разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, можуть утворювати заміщений або незаміщений

C₃-C₇-циклоалкіл;

- X, який може бути однаковим або різним, означає атом галогену; нітро; ціано; гідроксил; сульфаніл; аміно; пентафтор-λ.6-сульфаніл; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламіно; ді-C₁-C₈-алкіламіно; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-галогеноалкеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-галогеноалкініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-галогеноалкенілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкінілокси; C₂-C₈-галогеноалкінілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; C₃-C₇-галогеноциклоалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; форміл; формілокси; форміламіно; карбокси; карбамоїл; N-гідроксикарбамоїл; карбамат; (гідроксііміно)-C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеноалкілкарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; 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-галогеноалкоксикарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламінокарбоніл; ді-C₁-C₈-алкіламінокарбоніл; C₁-C₈-алкілкарбонілокси; C₁-C₈-галогеноалкілкарбонілокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілкарбоніламіно; C₁-C₈-галогеноалкілкарбоніламіно, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси; ді-C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси; C₁-C₈-алкілоксикарбонілокси; C₁-C₈-алкілсульфеніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкоксііміно; (C₁-C₈-алкоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; (C₁-C₈-алкенілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; (C₁-C₈-алкінілоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; (бензилоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; три(C₁-C₈-алкіл)силіл; три(C₁-C₈-алкіл)силіл-C₁-C₈-алкіл; бензилокси, який може бути заміщений до 5 груп Q; бензилсульфаніл, який може бути заміщений до 5 груп Q; бензиламіно, який може бути заміщений до 5 груп Q; нафтил, який може бути заміщений до 6 груп Q; фенокси, який може бути заміщений до 5 груп Q; феніламіно, який може бути заміщений до 5 груп Q; фенілсульфаніл, який може бути заміщений до 5 груп Q; фенілметилен, який може бути заміщений до 5 груп Q; феніл, який може бути заміщений до 5 груп Q; піридиніл, який може бути заміщений до чотирьох груп Q; піридинілокси, який може бути заміщений до чотирьох груп Q;

- два замісника X, разом з наступними атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, можуть утворювати 5- або 6-членний, насичений, карбо- або гетероцикл, який може бути заміщений до чотирьох груп Q, які можуть бути однаковими або різними;

- n означає 1, 2, 3, 4 або 5;

- R, який може бути однаковим або різним, означає атом водню; атом галогену; ціано; нітро; аміно; сульфаніл; пентафтор-λ.6-сульфаніл; C₁-C₈-алкіламіно; ді-C₁-C₈-алкіламіно; три(C₁-C₈-алкіл)силіл; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфаніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-галогеноалкеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-галогеноалкініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкенілокси; C₂-C₈-алкінілокси; C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-алкоксііміно; (C₁-C₈-алкоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; (бензилоксііміно)-C₁-C₈-алкіл; фенокси; бензилокси; бензилсульфаніл; бензиламіно; нафтил; галогенофенокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеноалкілкарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-галогеноалкоксикарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкіламінокарбоніл; ді-C₁-C₈-алкіламінокарбоніл;

- R^a та R^b, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкіл; C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-галогеноалкеніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-галогеноалкініл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₈-алкіл; C₃-C₇-галогеноциклоалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; форміл; C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеноалкілкарбоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеноалкілсульфоніл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; феніл, який може бути заміщений до 5 груп Q; нафтил, який може бути заміщений до 6 груп Q; фенілметилен, який може бути заміщений до 5 груп Q; фенілсульфоніл, який може бути заміщений до 5 груп Q;

- Q, який може бути однаковим або різним, означає атом галогену; ціано; нітро; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; три(C₁-C₈-алкіл)силіл та три(C₁-C₈-алкіл)силіл-C₁-C₈-алкіл;

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

Будь-яка сполука згідно з винаходом може існувати в одній або більше оптичній або хіральній ізомерній формах, в залежності від кількості асиметричних центрів в сполуці. Таким чином, винахід в рівній мірі стосується

усіх оптичних ізомерів та їхніх рацемічних або скалемічних сумішей (термін "скалемічний" означає суміш енантіомерів в різних пропорціях), а також сумішей усіх можливих стереоізомерів, в будь-яких співвідношеннях. Діастереоізомери та/або оптичні ізомери можуть бути розділені за допомогою методів, відомих спеціалістам в даній галузі.

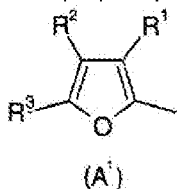
Будь-яка сполука згідно з винаходом також може існувати в одній або більше геометричній ізомерній формах, в залежності від кількості подвійних зв'язків у сполуці. Таким чином, винахід в рівній мірі стосується всіх геометричних ізомерів та всіх можливих сумішей, в будь-яких співвідношеннях. Геометричні ізомери можна розділяти за допомогою загальних методів, відомих спеціалістам в даній галузі.

Для сполук згідно з винаходом загальні терміни використовують з наступними значеннями:

- галоген означає один з фтору, бром, хлору або йоду;
- гетероатомом може бути азот, кисень або сірка;
- будь-яка алкільна група, алкенільна група або алкінільна група можуть бути прямими або розгалуженими;
- у випадку, коли аміногрупа або аміночастина будь-якої аміновмісної групи заміщена двома замісниками, які можуть бути однаковими або різними, два замісники, разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклічну групу, переважно 5-7-членну гетероциклічну групу, яка може бути заміщена та може містити інші гетероатоми, наприклад морфоліно або піперидиніл.

Переважаючими сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких А вибраний з переліку, що включає:

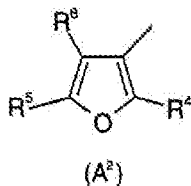
- гетероцикл формули (A¹)



де:

R¹-R³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

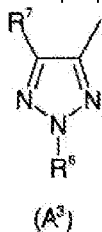
- гетероцикл формули (A²)



де:

R⁴-R⁷, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A³)

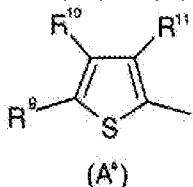


де:

R⁸ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A⁴)

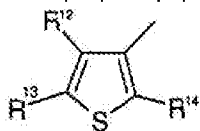


де:

R¹⁰-R¹³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; аміно; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути

однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A⁵)



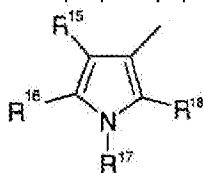
(A⁵)

де:

R¹² та R¹³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; аміно; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁴ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; аміно; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A⁶)



(A⁶)

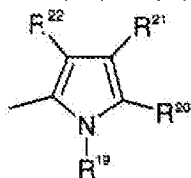
де:

R¹⁵ означає атом водню; атом галогену; ціано; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁶ та R¹⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкоксикарбоніл; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁷ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A⁷)



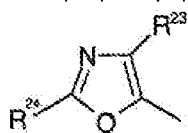
(A⁷)

де:

R¹⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

R²⁰-R²², які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A⁸)



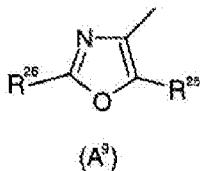
(A⁸)

де:

R²³ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R²⁴ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A⁹)

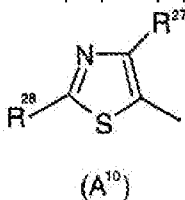


де:

R²⁵ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R²⁶ означає атом водню; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A¹⁰)

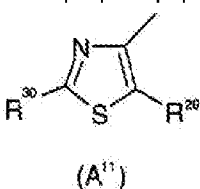


де:

R²⁷ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R²⁸ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; C₁-C₅-алкіламіно або ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

- гетероцикл формули (A¹¹)

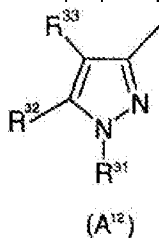


де:

R²⁹ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³⁰ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; C₁-C₅-алкіламіно або ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

- гетероцикл формули (A¹²)



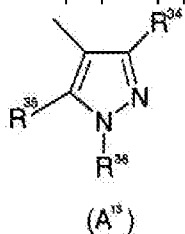
де:

R³¹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

R³² означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³³ означає атом водню; атом галогену; нітро; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A¹³)



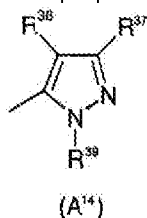
де:

R³⁴ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₃-C₅-Циклоалкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкінілокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³⁵ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; ціано; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; C₁-C₅-алкіламіно або ді-(C₁-C₅-алкіл)аміно;

R³⁶ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A¹⁴)

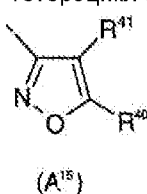


де:

R³⁷ та R³⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-алкілсульфаніл;

R³⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

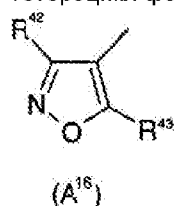
- гетероцикл формули (A¹⁵)



де:

R⁴⁰ та R⁴¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

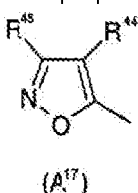
- гетероцикл формули (A¹⁶)



де:

R⁴² та R⁴³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або аміно;

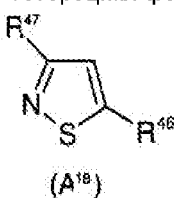
- гетероцикл формули (A¹⁷)



де:

R⁴⁴ та R⁴⁵, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A¹⁸)



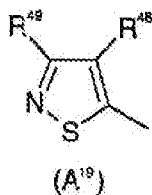
де:

R⁴⁷ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁴⁶ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які

можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-алкілсульфаніл;

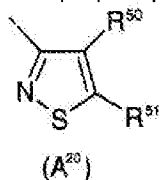
- гетероцикл формули (A¹⁹)



де:

R⁴⁹ та R⁴⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

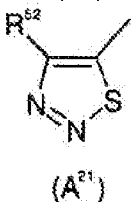
- гетероцикл формули (A²⁰)



де:

R⁵⁰ та R⁵¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

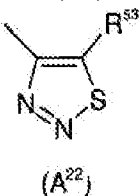
- гетероцикл формули (A²¹)



де:

R⁵² означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

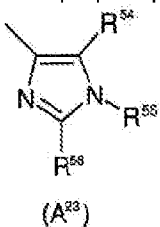
- гетероцикл формули (A²²)



де:

R⁵³ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероцикл формули (A²³)

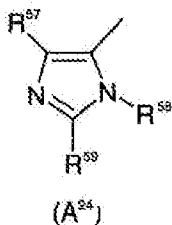


де:

R⁵⁴ та R⁵⁶, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁵⁵ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A²⁴)

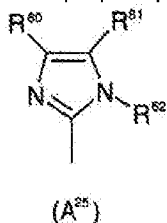


де:

R⁵⁷ та R⁵⁹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁵⁸ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A²⁵)

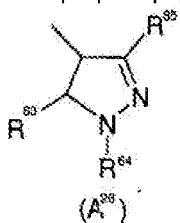


де:

R⁶⁰ та R⁶¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁶² означає атом водню або C₁-C₅-алкіл;

- гетероцикл формули (A²⁶)



де:

R⁶⁵ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; C₃-C₅-циклоалкіл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкінілокси або C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁶³ означає атом водню; атом галогену; C₁-C₅-алкіл; ціано; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₅-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; C₁-C₅-алкіламіно або ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

R⁶⁴ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл.

Більш переважними сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких А вибраний з переліку, що включає А²; А⁶; А¹⁰ та А¹³, як зазначено вище.

Іншими переважними сполуками формули (I) згідно з винаходом є сполуки, в яких Т означає сірку.

Іншими переважними сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких Z¹ означає C₃-C₇-циклоалкіл, заміщений до 10 груп або атомів, які можуть бути однаковими або різними та які можуть бути вибрані з переліку, що включає атоми галогену; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси або C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; більш переважно, Z¹ означає незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл; ще більш переважно Z¹ означає циклопропіл.

Іншими переважними сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких Х, який може бути однаковим або різним, означає атом галогену; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; три(C₁-C₈-алкіл)силіл; C₁-C₈-алкокси або C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними. Ще більш переважними сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких два послідовних замісника Х разом з фенільним кільцем утворюють заміщений або незаміщений 1,3-бензодіоксоліл; 1,2,3,4-тетрагідро-хіноксалініл; 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазініл; 1,4-бензодіоксаніл; інданіл; 2,3-дигідробензофураніл; індолініл.

Іншими переважними сполуками згідно з винаходом є сполуки формули (I), в яких R, який може бути однаковим або різним, означає атом водню; атом галогену; ціано; C₁-C₈-алкіламіно; ді-C₁-C₈-алкіламіно; три(C₁-C₈-алкіл)силіл; C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеноалкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-алкілсульфаніл; аміно; гідроксил; нітро; C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₂-C₈-алкінілокси.

Вищезазначені переважні варіанти замісників сполук згідно з винаходом можна комбінувати будь-яким чином. Такі комбінації переважних ознак утворюють підкласи сполук винаходу. Прикладами таких підкласів переважних сполук можуть бути поєднання:

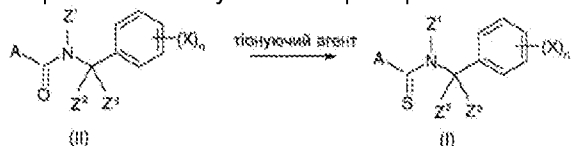
- переважні значення А з переважними значеннями Т, Z¹, Z², Z³, Х, n, R та Q;

- переважні значення Т з переважними значеннями А, Z¹, Z², Z³, X, n, R та Q;
- переважні значення Z¹ з переважними значеннями А, Т, Z², Z³, X, n, R та Q;
- переважні значення Z² з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z³, X, n, R та Q;
- переважні значення Z³ з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z², X, n, R та Q;
- переважні значення X з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z², Z³, n, R та Q;
- переважні значення n з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z², Z³, X, R та Q;
- переважні значення R з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z², Z³, X, n та Q;
- переважні значення Q з переважними значеннями А, Т, Z¹, Z², Z³, X, R та n.

В цих комбінаціях переважних значень залишків сполук згідно з винаходом такі залишки також можуть бути вибрані з ще більш переважних залишків кожної з А, Т, Z¹, Z², Z³, X, n, R та Q таким чином, щоб отримати ще більш переважні підкласи сполук винаходу.

Даний винахід також стосується способу одержання сполук формули (I).

Таким чином, наступним аспектом винаходу є спосіб P1 одержання сполук формули (I), в яких Т означає S, як зображено на наступній схемі реакції:



Спосіб P1

де А, Z¹-Z³, Х та n є такими, як зазначено вище.

Спосіб P1 можна проводити в присутності тіонуючого агента.

Амідні похідні формули (II) є відомими або можуть бути одержані відомими способами, наприклад таким, як описано в Європейській заявці на патент EP-06/356008.

Придатними тіонуючими агентами для здійснення способу згідно з винаходом можуть бути сірка (S), сірководнева кислота (H₂S), сульфід натрію (Na₂S), гідросульфід натрію (NaHS), трисульфід бору (B₂S₃), біс(діетиламіній) сульфід ((AlEt₂)₂S), сульфід амонію ((NH₄)₂S), пентасульфід фосфору (P₂S₅), реагент Лавесона (2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,2,3,4-дитіадифосфетан 2,4-дисульфід) або тіонуючі агенти на полімерній основі, як описано в J. Chem. Soc. Perkin 1, (2001), 358, в присутності або за відсутності каталітичної або стехіометричної кількості основи, такої як неорганічна або органічна основа. Перевагу надають використанню карбонатів лужних металів, таким як карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію; гетероциклічним ароматичним основам, таким як піридин, піколін, лютинин, колідин; а також третинним амінам, таким як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметиламінопіридин або N-метилпіридин.

Придатними розчинниками для здійснення способу P1 згідно з винаходом можуть бути звичайні інертні органічні розчинники. Перевагу надають необов'язково галогенованим аліфатичним, аlicyclic або ароматичним вуглеводням, таким як петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, дихлоретан або трихлоретан; етерам, таким як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил трет-бутиловий етер, метил трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан або 1,2-діетоксіетан; нітрилам, таким як ацетонітрил, пропіонітрил, n- або і-бутиронітрил або бензонітрил; сірчистим розчинникам, таким як сульфолан або дисульфід вуглецю.

При здійсненні способу P1 згідно з винаходом температуру реакції можна варіювати у відносно широких межах. Зазвичай ці способи проводять при температурі від 0 °C до 160 °C, переважно від 10 °C до 120 °C. Для контролювання температури процесу використовують мікрохвильову технологію.

Спосіб P1 згідно з винаходом, як правило, здійснюють при атмосферному тиску. Також можливий варіант при зниженому або підвищеному тиску.

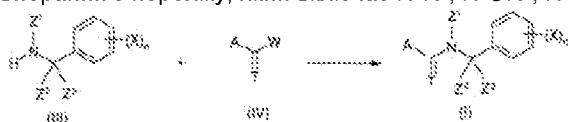
При здійсненні способу P1 згідно з винаходом використовують 1 моль або надлишок еквіваленту сірки тіонуючого агента та від 1 до 3 молей основи на моль амідного похідного формули (II).

Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

Змішування проводять будь-яким відомим методом.

Зазвичай реакційну суміш концентрують при зниженому тиску. Залишок може бути відділений від можливо присутніх домішок за допомогою відомих методів, таких як хроматографія або рекристалізація.

Згідно з наступним аспектом винаходу, пропонується спосіб P2 одержання сполук формули (I), в яких Т вибраний з переліку, який включає N-R^a, N-OR^a, N-NR^aR^b або N-CN, як зображено на наступній схемі реакції:



Спосіб P2

де

А, Z¹-Z³, W¹-W⁵ та В є такими, як визначено вище;

U² означає атом хлору або метилсульфанільну групу.

В способі P2 згідно з винаходом стадію 2 проводять в присутності зв'язуючого кислоти та в присутності розчинника.

N-циклоалкіл-амінні похідні формули (I) є відомими або можуть бути одержані відомими способами, такими як відновне амінування альдегідів або кетонів (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006, р 214, синтез сполук 7 та 8) або відновлення імінів (Tetrahedron, 2005, р 11689), або нуклеофільне заміщення галогену,

мезилату або тозилату (Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887, одержання інтермедиату для сполуки 28).

N-заміщений карбоксимідоїл хлорид формули (IV) є відомим або може бути одержаний відомими способами, наприклад, як описано в Houben-Weyl, "Methoden der organischen Chemie" (1985) E5/1, p 628-633 та Patai "The chemistry amidines and imidates" (1975), p 296-301.

N-заміщений або N,N'-дизаміщений гідразоноїл хлорид формули (IV) є відомим або може бути одержаний відомими способами, наприклад, як описано в Tetrahedron, 1991, 47, p 447 та Journal of Heterocyclic Chemistry, 1983, 20, p 225.

N-ціано карбоксимідоїл хлорид формули (IV) є відомим або може бути одержаний відомими способами, наприклад, як описано в Tetrahedron Letters, 1968, p 5523 та Bioorganic and Medicinal Chemistry, 2006, p 4723.

Придатними зв'язуючими кислот для здійснення способу P2 згідно з винаходом можуть бути неорганічні та органічні основи, відомі для таких реакцій. Перевага надається використанню лужноземельних металів або гідроксидів лужноземельних металів, таких як гідроксид натрію, гідроксид кальцію, гідроксид калію або гідроксид амонію; карбонатів лужних металів, таких як карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію; ацетатів лужних або лужноземельних металів, таких як ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію; гідридів лужних або лужноземельних металів, таких як гідрид натрію або гідрид калію; алкоголятів лужних або лужноземельних металів, таких як метилат натрію, етилат натрію, пропілат натрію або трет-бутилат натрію; а також третинних амінів, таких як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиламінін, піридин, N-метилпіперидин, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундекан (DBU); або поглиначів кислоти на полімерній основі (наприклад, як розкрито в <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

Також можливо працювати за відсутності будь-якого додаткового зв'язуючого кислоти.

Придатними розчинниками для здійснення способу P2 згідно з винаходом можуть бути звичайні інертні органічні розчинники. Перевагу надають небов'язковим галогенованим аліфатичним, аlicyclicним або ароматичним вуглеводням, таким як петролейний етер, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, дихлоретан або трихлоретан; етерам, таким як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил трет-бутиловий етер, метил трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан або 1,2-діетоксіетан або анізол; нітрилам, таким як ацетонітрил, пропіонітрил, n- або i-бутиронітрил або бензонітрил; амідам, таким як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-диметилформанілід, N-диметилпіролідон або гексаметилфосфор триамід; естерам, таким як метилацетат або етилацетат, сульфоксидам, таким як диметилсульфоксид, або сульфонам, такі як сульфолан.

При здійсненні способу P2 згідно з винаходом температуру реакції можна варіювати у відносно широких межах. Зазвичай способи проводять при температурі від 0 °C до 160 °C, переважно від 10 °C до 120 °C. Для контролювання температури процесу використовують мікрохвильову технологію.

Спосіб P2 згідно з винаходом, як правило, здійснюють при атмосферному тиску. Також можливий варіант при зниженому або підвищеному тиску.

При здійсненні способу P2 згідно з винаходом аміне похідне формули (III) можна застосовувати у вигляді солі, такої як хлорідрат або будь-якої іншої звичайної солі.

При здійсненні способу P2 згідно з винаходом використовують 1 моль або надлишок амінного похідного формули (II) та від 1 до 3 молей зв'язуючого кислоти на моль N-заміщеного карбоксимідоїл хлориду формули (IV).

Також можливо використовувати компоненти реакції в інших співвідношеннях.

Змішування проводять будь-якими відомими методами.

Зазвичай реакційну суміш концентрують при зниженому тиску. Отриманий залишок може бути відділений від можливо присутніх домішок за допомогою відомих методів, таких як хроматографія або рекристалізація.

Сполуки формули (I) згідно з винаходом можуть бути одержані згідно з вищеописаними способами. Однак, має бути зрозуміло, що на основі загальних знань та доступних публікацій кваліфікований спеціаліст буде в змозі застосувати ці способи до особливостей кожної сполуки, яку бажає синтезувати.

Згідно з наступним аспектом, даний винахід стосується фунгіцидної композиції, яка містить ефективну та нефітотоксичну кількість активної сполуки формули (I). Вираз "ефективна та нефітотоксична кількість" означає кількість композиції згідно з винаходом, яка є ефективною для боротьби або зниження грибів, присутніх або здатних з'явитися на культурах, та яка не приводить до будь-яких значних симптомів фітотоксичності для даної культури. Таку кількість можна вибирати в широких межах, в залежності від виду гриба, з яким борються, культури рослини, кліматичних умов та сполук, які входять до складу композиції згідно з винаходом.

Цю кількість можна визначити за допомогою систематичних польових досліджень, які є відомими спеціалісту рівня техніки.

Таким чином, згідно з винаходом пропонується фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки формули (I), описаної вище, та придатну в сільському господарстві основу, носій або наповнювач. Згідно з винаходом термін "основа" стосується природної або синтетичної, органічної або неорганічної сполуки, з якою комбінують або поєднують сполуку формули (I) для полегшення застосування, в основному щодо частин рослин. Ця основа зазвичай інертна та повинна бути придатна для використання в сільському господарстві. Основа може бути твердою або рідкою. Приклади придатних основ включають глини, природні або синтетичні силікати, кремнезем, смоли, тверді добрива, воду, спирти, переважно бутанол, органічні розчинники, мінеральні та рослинні масла та їхні похідні. Також можна використовувати суміші цих основ.

Композиція згідно з винаходом також може містити додаткові компоненти. Переважно, композиція додатково містить поверхнево-активну сполуку. Поверхнево-активною сполукою може бути емульгатор, диспергуючий агент або змочувальна речовина іонного або неіоногенного типу або суміш цих поверхнево-активних сполук. Прикладами можуть бути солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонові кислоти, солі фенолсульфонові кислоти або нафталінсульфонові кислоти, поліконденсати етиленоксиду з жирними спиртами або з жирними

кислотами, або з жирними амінами, заміщені феноли (переважно алкілфеноли або арилфеноли), солі естерів сульфобурштинової кислоти, тауринові похідні (переважно алкілтаурати), фосфорні естери поліоксіетильованих спиртів або фенолів, естери жирних кислот та поліолів, та похідні вищезазначених сполук, які містять сульфатні, сульфонатні та фосфатні групи. Присутність принаймні однієї поверхнево-активної сполуки особливо бажана, коли активна сполука та/або основа є нерозчинними в воді та коли переносним агентом для застосування є вода. Переважно, вміст поверхнево-активної сполуки складає від 5 % до 40 % мас. композиції.

Необов'язково, додаткові компоненти можуть також включати, наприклад захисні колоїди, адгезиви, загущувачі, тиксотропні агенти, проникаючі агенти, стабілізатори, зв'язуючі сполуки. Більш загально, активну сполуку можна комбінувати з будь-якою твердою або рідкою добавкою, яка задовольняє звичайним технологіям.

В цілому, композиція згідно з винаходом може містити від 0,05 до 99 % мас. активної сполуки, переважно 10-70 % мас.

Композицію згідно з винаходом можна застосовувати в різному вигляді, такому як аерозольний розпилювач, суспензія капсули, холодний орошуючий концентрат, пилеутворювальний порошок, емульгувальний концентрат, емульсія масло у воді, емульсія вода у маслі, енкапсульована гранула, тонкодисперсна гранула, текучий концентрат для обробки насіння, газ (під тиском), газогенеруючий продукт, гранула, гарячий орошуючий концентрат, макрогранула, мікрогранула, диспергуючий в маслі порошок, змішувальний з маслом текучий концентрат, змішувальна з маслом рідина, паста, порошок для сухої обробки насіння, насіння, покриті пестицидом, розчинний концентрат, розчинний порошок, розчин для обробки насіння, концентрат суспензії (текучий концентрат), рідина наднизького об'єму (ULV), суспензія наднизького об'єму (ULV), диспергуючі у воді гранули або таблетки, диспергуючий у воді порошок для обробки суспензії, водорозчинні гранули або таблетки, водорозчинний порошок для обробки насіння та змочувальний порошок. Ці композиції включають не лише композиції, які готові до нанесення на рослини або насіння відомими засобами, такими як розпилювальні пристрої або пристрої для пудри, а також концентровані комерційні композиції, які необхідно розводити перед застосуванням.

Композиції згідно з винаходом також можна змішувати з одним або більше інсектицидами, фунгіцидами, бактерицидами, атрактантами, акарицидами або феромонами або іншими сполуками з біологічною активністю. Одержані таким чином суміші мають розширений спектр дії. Особливо ефективними є суміші з іншими фунгіцидними сполуками.

Приклади придатних фунгіцидних співагентів можуть бути вибрані з наступного переліку:

(1) Інгібітори синтезу нуклеїнових кислот, наприклад беналаксил, беналаксил-М, бупіримат, клозилаконт, диметиримол, етиримол, фуралаконт, гімексазол, металаксил, металаксил-М, офурас, оксадиконт та оксолінова кислота.

(2) Інгібітори мітозу та поділу клітини, наприклад беноміл, карбендазім, хлорфеназол, діетофенкарб, етаксам, фуберідазол, пенцикурон, тіабендазол, тіофанат, тіофанат-метил та зоксамід.

(3) Інгібітори дихання, наприклад дифлеметорим як Cl-інгібітор дихання, біксафен, боксалід, фенфурам, флуопірам, фурмециклокс, ізопіразам (9R-компонент), ізопіразам (9B-компонент), мепроніл, оксикарбоксин, пентіопірад, трифлузамід як CII-інгібітор дихання, амисульбром, азоксистробін, ціазофамід, димоксистробін, еностробурін, фамоксадон, фенамідон, флуоксастробін, крезоксім-метил, метоміностробін, орисастробін, пікоксистробін, піраклостробін, пірибенкарб, трифлуксистробін як CIII-інгібітор дихання

(4) Сполуки, здатні діяти як роз'єднувальний агент, як наприклад бінапакрил, дінокап, флуазінам та мептилдінокап.

(5) Інгібітори утворення АДФ, наприклад фентін ацетат, фентин хлорид, фентин гідроксид та силтіофарм.

(6) Інгібітори біосинтезу амінокислот та/або протеїнів, наприклад андопрім, бластицидин-S, ципродиніл, касугаміцин, касугаміцин гідрохлорид гідрат, мепаніпірим та піриметаніл.

(7) Інгібітори сигнальної трансдукції, наприклад фенпіклоніл, флудіоксоніл та хіноксифен.

(8) Інгібітори ліпідного та мембранного синтезу, наприклад біфеніл, хлоролінат, едіфенфос, етрідіазол, йодокарб, іпродіон, ізопротіолан, процимідон, пропамокарб, пропамокарб гідрохлорид, піразофос, толклофос-метил та вінклозолін.

(9) Інгібітори біосинтезу ергостеролу, наприклад алдіморф, азаконазол, бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, диклобутразол, дифеноконазол, диніконазол, диніконазол-М, додеморф, додеморф ацетат, епоксиконазол, етаконазол, фенарімор, фенбуконазол, фенгексамід, фенпропідин, фенпропіморф, флукінконазол, флурпрімідол, флузілазол, флутріафол, фенконазол, фенконазол-цис, гексаконазол, імазаліл, імазаліл сульфат, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, нафтіфін, нуарімор, окспоконазол, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, піпералін, прохлораз, пропіконазол, протіоконазол, пірибутікарб, пірифенокс, хінконазол, сімеконазол, спіроксамін, тебуконазол, тербінафін, тетраконазол, тріадімефон, тріадіменол, тридеморф, трифлумізол, трифорін, трітіконазол, уніконазол, веніконазол та воріконазол.

(10) Інгібітори синтезу стінок клітин, наприклад бентіавалікарб, диметоморф, флуморф, іпровалікарб, мандипроамід, поліоксини, поліоксорім, протіокарб, валідаміцин А та валіфенал.

(11) Інгібітори біосинтезу меланіну, наприклад карпропамід, диклоцимет, феноксаніл, фталід, пірохілон та трициклазол.

(12) Сполуки, здатні стимулювати імунну систему, як наприклад ацибензолар-S-метил, пробеназол та тіадиніл.

(13) Сполуки, здатні виявляти мультисайтову дію, як наприклад бордоська суміш, каптафол, каптан, хлороталоніл, нафтенат міді, оксид міді, оксихлорид міді, препарати міді, такі як гідроксид міді, сульфат міді, дихлофлуанід, дитіанон, додін, вільна основа додіну, фербам, флорофолпет, фолпет, гуазатін, гуазатін ацетат, іміноктадин, іміноктадин албесілат, іміноктадин триацетат, манкопер, манкозеб, манеб, метірам, метірам цинк, оксин-копер, пропамідин, пропінеб, сірка та препарати сірки, включаючи полісульфід кальцію, тірам, толіфлуанід, зінеб та зірам.

(14) Додаткові сполуки, як наприклад 2,3-дибутил-6-хлортієно[2,3-d]піримідин-4(3H)-он, етил (2Z)-3-аміно-2-ціано-3-фенілпроп-2-еноат, N-[2-(1,3-диметилбутил)феніл]-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід, N-{2-1,1'-бі(циклопропіл)-2-іл}феніл]-3-(дифлорметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (2E)-2-(2-[[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпіримідин-4-іл]окси]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід, (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-дихлорфеніл)бут-3-ен-2-іліден}аміно}окси]метил]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід, 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)піридин-3-карбоксамід, N-(3-етил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-5-метокси-2-метил-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден}аміно}окси]метил]феніл)-2,4-дигідро-3H-1,2,4-триазол-3-он, (2E)-2-(метоксиіміно)-N-метил-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден}аміно}окси]метил]феніл)етанамід, (2E)-2-(метоксиіміно)-N-метил-2-{2-[[{(E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етоксиіміно}метил]феніл]етанамід, (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-(E)-1-фтор-2-фенілетеніл]окси]феніл]етиліден}аміно}окси]метил]феніл)-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід, 1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклогептанол, метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл)-1H-імідазол-5-карбоксилат, N-етил-N-метил-N'-[2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-триметилсиліл]пропокси]феніл]імідоформамід, N'-(5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсиліл)пропокси]феніл)-N-етил-N-метилімідоформамід, O-{1-[4-метоксифенокси]метил}-2,2-диметилпропіл} 1H-імідазол-1-карботіоат, N-[2-(4-[[3-(4-хлорфеніл)проп-2-ін-1-іл]окси]-3-метоксифеніл)етил]-N2-(метилсульфоніл)валінамід, 5-хлор-7-(4-метилпіперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифторфеніл)[1,2,4]триазоло[1,5-a]піримідин, 5-аміно-1,3,4-тіадіазол-2-тіол, пропамокارب-фосетил, 1-[[4-метоксифенокси]метил]-2,2-диметилпропіл 1H-імідазол-1-карбоксилат, 1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-3-(трифторметил)-1H-піразол-4-карбоксамід, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин, 2-бутоксид-6-йодо-3-пропіл-4H-хромен-4-он, 2-фенілфенол та солі, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-1H-піразол-4-карбоксамід, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,3,3,3-гексафторпропокси)феніл]-1H-піразол-4-карбоксамід, 3,4,5-трихлорпіридин-2,6-дикарбонітрил, 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметилізоксазолідин-3-іл]піридин, 3-хлор-5-(4-хлорфеніл)-4-(2,6-дифторфеніл)-6-метилпіридазин, 4-(4-хлорфеніл)-5-(2,6-дифторфеніл)-3,6-диметилпіридазин, хінолін-8-ол, хінолін-8-ол сульфат (2:1) (сіп), бентіазол, бетоксазин, капсаміцин, карвон, хінометіонат, хлороніб, куфраніб, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципросульфамід, дазомет, дебакарб, дихлорофен, дикломезин, диклоран, дифензокват, дифензокват метилсульфат, дифеніламін, екомат, ферімзон, флуметовер, флуопіколід, флуороїмід, флузульфамід, фосетил-алюміній, фосетил-кальцій, фосетил-натрій, гексахлорбензол, ірумаміцин, ізотіаніл, метасульфокارب, метил (2E)-2-[2-[[{циклопропіл}[(4-метоксифеніл)іміно]метил]тіо]метил]феніл]-3-метоксиакрилат, метил ізотіоціанат, метрафенон, (5-бromo-2-метокси-4-метилпіридин-3-іл)(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)метанон, милдіоміцин, толніфанід, N-(4-хлорбензил)-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, N-[[4-хлорофеніл]ціано]метил]-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, N-[[5-бromo-3-хлорпіридин-2-іл]метил]-2,4-дихлорпіридин-3-карбоксамід, N-[1-(5-бromo-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2,4-дихлорпіридин-3-карбоксамід, N-[1-(5-бromo-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2-фторо-4-йодопіридин-3-карбоксамід, N-{(Z)-[(циклопропілметокси)іміно][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл]метил}-2-фенілацетамід, N-{(E)-[(циклопропілметокси)іміно][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл]метил}-2-фенілацетамід, натаміцин, нікель диметилдитіокарбамат, нітротал-ізопропіл, окстилінон, оксамокارب, оксифентиін, пентахлорофенол та солі, феназин-1-карбонова кислота, фенотрин, фосфорна кислота та її солі, пропамокارب фосетилат, пропанозин-натрій, прохіназид, піролінтрин, хінтозен, S-проп-2-ен-1-іл 5-аміно-2-(1-метилетил)-4-(2-метилфеніл)-3-оксо-2,3-дигідро-1H-піразол-1-карботіоат, теклофталам, текназен, триазид, трихламід, 5-хлоро-N'-феніл-N'-проп-2-ін-1-ілтіофен-2-сульфогідрозид та зариламід.

Особливо ефективною також може бути композиція згідно з винаходом, яка містить суміш сполуки формули (I) з бактерицидною сполукою. Приклади придатних бактерицидних сполук можуть бути вибрані з наступного переліку: бронопол, дихлорофен, нітрапирин, нікель диметилтіокарбамат, казугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші сполуки міді.

Сполуку формули (I) та фунгіцидну композицію згідно з винаходом можна застосовувати для боротьби або попередження появи фітопатогенних грибів рослин або культур.

Таким чином, наступним об'єктом винаходу є спосіб попередження або боротьби з фітопатогенними грибами рослин або культур, який відрізняється тим, що сполуку формули (I) або фунгіцидну композицію згідно з винаходом наносять на насіння, рослину або плоди рослини або ґрунт, в якому рослина росте або має рости. Спосіб обробки згідно з винаходом також може бути придатним для обробки розмножувального матеріалу, такого як бульби або кореневище, а також насіння, розсади або пікірованої розсади та рослини або пікірованої рослини. Цей спосіб обробки також може бути придатним для обробки коріння. Спосіб обробки згідно з винаходом також може бути придатним для обробки відкритих частин рослин, таких як стовбури, стебла або ніжки, листя, квіти та плоди рослин.

Серед рослин, які можна захищати способом згідно з винаходом, увагу приділяють бавовні, льону, винограду, фруктовим та овочевим культурам, таким як Rosaceae sp. (наприклад, одностінним плодовим, таким як яблуні та груші, а також кісточковим, таким як абрикоси, мигдаль та персики), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (наприклад, бананові дерева та плантації), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (наприклад, лимони, апельсини та грейпфрут), Solanaceae sp. (наприклад, томати), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (наприклад, латук), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp., Papilionaceae sp. (наприклад, горох), Rosaceae sp. (наприклад, полуниця), основним культурам, таким як Graminae sp. (наприклад, кукурудза, газон або зернові, такі як пшениця, жито, рис, ячміно та тритікале), Asteraceae sp. (наприклад, соняшник), Cruciferae sp. (наприклад, рапс), Fabaceae sp. (наприклад, арахіс), Papilionaceae sp. (наприклад, соя), Solanaceae sp. (наприклад, картопля), Chenopodiaceae sp. (наприклад, буряк), Elaeis sp. (наприклад, пальмова олія); садовим та лісовим культурам; а також генетично модифікованим гомологам цих культур.

Серед хвороб рослин та культур, з якими можна боротися за допомогою способу згідно з винаходом, можна виділити наступні:

- Мучниста роса, така як
Мучниста роса, викликана, наприклад *Blumeria graminis*;
Мучниста роса, викликана, наприклад *Podosphaera leucotricha*;
Мучниста роса, викликана, наприклад *Sphaerotheca fuliginea*;
Мучниста роса, викликана, наприклад *Uncinula necator*;
- Іржа, така як
Іржа, викликана, наприклад *Gymnosporangium sabinae*;
Іржа, викликана, наприклад *Hemileia vastatrix*;
Іржа, викликана, наприклад *Phakopsora pachyrhizi* та *Phakopsora meibomia*;
Іржа, викликана, наприклад *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* та *Puccinia striiformis*;
Іржа, викликана, наприклад *Uromyces appendiculatus*;
- Захворювання, викликані ооміцетами, такі як
Альбуга або біла іржа, викликана, наприклад *Albugo Candida*;
Мучниста роса салата, викликана, наприклад *Bremia lactucae*;
Пероноспороз, викликаний, наприклад *Peronospora pisi* та *Peronospora brassicae*;
Фітофтороз, викликана, наприклад *Phytophthora infestans*;
Мучниста роса, викликана, наприклад *Plasmopara viticola*;
Псевдопероноспороз, викликаний, наприклад *Pseudoperonospora humuli* та *Pseudoperonospora cubensis*;
Коренева гниль, викликана, наприклад *Pythium ultimum*;
- Плямистість листя або захворювання листя, такі як
Альтернаріоз або суха плямистість, викликаний, наприклад *Alternaria solani*;
Церкоспороз, викликаний, наприклад *Cercospora beticola*;
Кладоспоріоз, викликаний, наприклад *Cladosporium cucumerinum*;
Гельмінтоспоріоз, викликаний, наприклад *Cochliobolus sativus* (Conidiaform: *Drechslera*, Syn.: *Helminthosporium*)
або *Cochliobolus miyabeanus*;
Антрактоз, викликаний, наприклад *Colletotrichum lindemuthianum*;
Антрактоз, викликаний, наприклад *Coccolonium oleaginum*;
Діапорте, викликана, наприклад *Diaporthe citri*;
Плямистий антрактоз, викликаний, наприклад *Elsinoe fawcettii*;
Антрактоз, викликаний, наприклад *Gloeosporium laeticolor*;
Антрактоз, викликаний, наприклад *Glomerella cingulata*;
Чорна гниль, викликана, наприклад *Guignardia bidwellii*;
Гниль стебел, викликана, наприклад *Leptosphaeria maculans* *Leptosphaeria nodorum*;
Перикуляріоз, викликаний, наприклад *Magnaporthe grisea*;
Пятнистість, викликана, наприклад *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* та *Mycosphaerella fijiensis*;
Септоріоз, викликаний, наприклад *Phaeosphaeria nodorum*;
Жовта плямистість, викликана, наприклад *Pyrenophora teres* або *Pyrenophora tritici perennis*;
Рамуляріоз, викликаний, наприклад *Ramularia collo-cygni* або *Ramularia areola*;
Ринхоспоріоз ячменя, викликаний, наприклад *Rhynchosporium secalis*;
Септоріоз, викликаний, наприклад *Septoria apii* *Septoria lycopersici*;
Тифульоз, викликана, наприклад *Thyphula incarnate*;
Парша, викликана, наприклад *Venturia inaequalis*;
- Захворювання коріння, оболонки, стебел, такі як
Гниль коріння, викликана, наприклад *Cottrichium graminearum*;
Фузаріозна гниль, викликана, наприклад *Fusarium oxysporum*;
Коренева гниль пшениці, викликана, наприклад *Gaeumannomyces graminis*;
Ризоктонія, викликана, наприклад *Rhizoctidium oryzae*;
Гниль, викликана, наприклад *Sarocladium oryzae*;
Склеротціальна гниль, викликана, наприклад *Sclerotium oryzae*;
Тапезія, викликана, наприклад *Tapesia acuformis*;
Чорна коренева гниль, викликана, наприклад *Thielaviopsis basicola*;
- Захворювання початка, суцвіття, включаючи кукурудзяний початок, такі як
Альтернаріоз, викликаний, наприклад *Alternaria spp.*;
Аспергільоз, викликаний, наприклад *Aspergillus flavus*;
Цвіль, викликана, наприклад *Cladosporium cladosporioides*;
Споринья, викликана, наприклад *Claviceps purpurea*;
Фузаріоз, викликаний, наприклад *Fusarium culmorum*;
Суха гниль, викликана, наприклад *Gibberella zeae*;
Сніжна цвіль, викликана, наприклад *Monographella nivalis*;
- Захворювання головнею, такі як
Головня, викликана, наприклад *Sphacelotheca reiliana*;
Тверда головня, викликана, наприклад *Tilletia caries*;
Стеблева головня, викликана, наприклад *Urocystis occulta*;
Пильна головня, викликана, наприклад *Ustilago nuda*;
- Плодова гниль та цвіль, такі як
Аспергільоз, викликаний, наприклад *Aspergillus flavus*;
Сіра цвіль, викликана, наприклад *Botrytis cinerea*;

Пеніциліоз або біла гниль, викликана, наприклад *Penicillium expansum* та *Penicillium purpurogenum*;
 Гірка гниль, викликана, наприклад *Rhizopus stolonifer*;
 Біла гниль, викликана, наприклад *Sclerotinia sclerotiorum*;
 Вертицильоз або суха гниль, викликана, наприклад *Verticillium albo-atrum*;
 - Хвороби, що передаються через насіння або ґрунт, цвіль, зів'янення, гниття та "чорна ніжка"
 Альтернаріоз, викликаний, наприклад *Alternaria brassicicola*;
 Коренева цвіль, викликана, наприклад *Aphanomyces euteiches*;
 Аскохитоз, викликаний, наприклад *Ascochyta lentis*;
 Аспергільоз, викликаний, наприклад *Aspergillus flavus*;
 Грибкова цвіль, викликана, наприклад *Cladosporium herbarum*;
 Гельмінтоспоріоз, викликаний, наприклад *Cochliobolus sativus*; (*Conidiaform:Drechslera*, *Bipolaris* Syn.: *Helminthosporium*);
 Антрактоз, викликаний, наприклад *Colletotrichum coccodes*;
 Фузаріоз, викликаний, наприклад *Fusarium culmorum*;
 Суха гниль, викликана, наприклад *Gibberella zeae*;
 Попільна гниль, викликана, наприклад *Macrophomina phaseolina*;
 Сніжна цвіль, викликана, наприклад *Microdochium nivale*;
 Фузаріоз, викликаний, наприклад *Monographella nivalis*;
 Цвіль, викликана, наприклад *Penicillium expansum*;
 Фомоз, викликаний, наприклад *Phoma lingam*;
 Чорна плямистість, викликана, наприклад *Phomopsis sojae*;
 Фітофтора, викликана, наприклад *Phytophthora cactorum*;
 Піренофороз або жовта плямистість, викликана, наприклад *Pyrenophora graminea*;
 Перкульозна гниль, викликана, наприклад *Pyricularia oryzae*;
 Коренева гниль, викликаний, наприклад *Pythium ultimum*;
 Ризоктоніоз, викликаний, наприклад *Rhizoctonia solani*;
 Гірка гниль, викликана, наприклад *Rhizopus oryzae*;
 Біла гниль, викликана, наприклад *Sclerotium rolfsii*;
 Септоріоз, викликана, наприклад *Septoria nodorum*;
 Сіра сніжна цвіль, викликана, наприклад *Typhula incarnata*;
 Веттицильоз або суха гниль, викликана, наприклад *Verticillium dahliae*;
 - Рак, відмирання, таке як
 Некроз, викликаний, наприклад *Nectria galligena*;
 - Згубні захворювання, таке як
 Моніліоз або плодова гниль, викликаний, наприклад *Monilinia laxa*;
 - Пузирчастість листя або курчавість листя, включаючи деформацію цвіту та плодів, такі як
 Курчавість листя, викликана, наприклад *Exobasidium vexans*;
 Курчавість листя, викликана, наприклад *Taphrina deformans*;
 - Відмирання дерев, таке як
 Еска, викликана, наприклад *Phaeomoniella clamydosporea*, *Phaeoacremonium aleophilum* та *Fomitiporia mediterranea*;
 Ганодерма, викликана, наприклад *Ganoderma boninense*;
 - Захворювання квіток та насіння, таке як
 Сіра гниль, викликана, наприклад *Botrytis cinerea*;
 - Захворювання бульби, таке як
 Ризоктоніоз, викликаний, наприклад *Rhizoctonia solani*;
 Гельмінтоспоріоз, викликаний, наприклад *Helminthosporium solani*;
 - Кіла капусти, така як
 Кіла, викликана, наприклад *Plasmiodiophora brassicae*;
 - Захворювання, викликані бактеріями, такі як
 Чорний бактеріоз, викликаний, наприклад *Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*;
 Базальний бактеріоз, викликаний, наприклад *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
 Бактеріальний опік, викликаний, наприклад *Erwinia amylovora*.

Фунгіцидну композицію згідно з винаходом можна застосовувати проти грибкових захворювань, здатних рости на деревині або всередині неї. Термін "деревина" охоплює всі види порід деревини, усі види обробки цієї деревини, призначеної для будівництва, наприклад масивна деревина, важка деревина, ламінована деревина та фанера. Спосіб обробки деревини згідно з винаходом в основному полягає в контактуванні однієї або більше сполук згідно з винаходом або композиції згідно з винаходом; він включає, наприклад, пряме застосування, розпилення, занурення, вприскування або будь-які інші придатні методи.

Доза активної сполуки, яку звичайно застосовують в способі обробки за винаходом в цілому та переважно складає від 10 до 800 г/га, переважно від 50 до 300 г/га при застосуванні для обробки листя. Доза активної сполуки, яку застосовують при обробці насіння, переважно складає від 2 до 200 г на 100 кг насіння, переважно від 3 до 100 г на 100 кг насіння.

Зрозуміло, що вищезазначені дози наведені лише як приклади для здійснення способу згідно з винаходом. Спеціаліст рівня техніки зможе вибрати дози для застосування, в основному в залежності від природи оброблюваної рослини або культури.

Фунгіцидну композицію згідно з винаходом можна застосовувати для обробки генетично модифікованих організмів сполуками згідно з винаходом або композицією згідно з винаходом. Генетично модифіковані рослини -

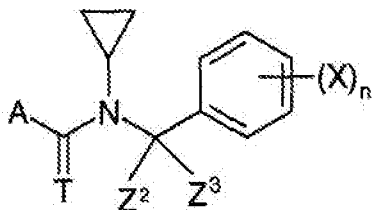
це рослини, до геному яких стабільно прищеплений інший ген із закодованим протеїном, який викликає інтерес. Термін "інший ген із закодованим протеїном, який викликає інтерес" по суті означає гени, які надають видозміненим рослинам нових агрономічних властивостей, або гени для покращення агрономічної якості модифікованої рослини.

Сполуки або суміші згідно з винаходом також можна застосовувати для приготування композиції, придатної для попередження або боротьби з грибковими захворюваннями людей або тварин, такими як, наприклад мікоцити, дерматози, стригучий лишай та кандидози або захворюваннями, викликаними *Aspergillus* spp., наприклад *Aspergillus fumigatus*.

В наступній таблиці показані різні аспекти винаходу з посиланням на приклади сполук, їх одержання та ефективності.

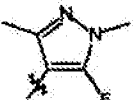
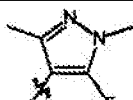
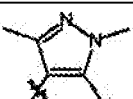
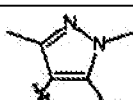
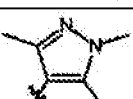
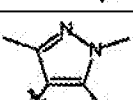
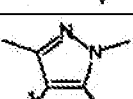
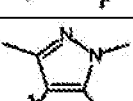
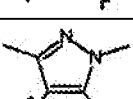
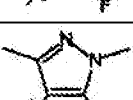
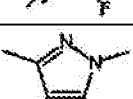
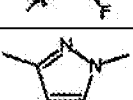
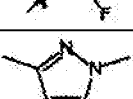
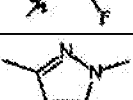
Таблиця ілюструє приклади сполук згідно з винаходом, але які не обмежують винахід.

В цій таблиці M+H (або M-H) означає молекулярно іонний пік, плюс або мінус 1 о.а.м. (одиниця атомної маси), відповідно, як досліджено в мас-спектроскопії, та M (ArCl⁺) означає молекулярно іонний пік, знайдений через хімічну іонізацію з атмосферним тиском в мас-спектроскопії.

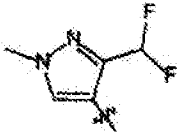
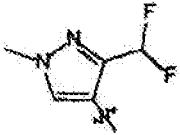
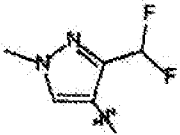
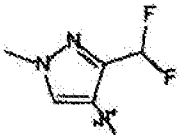
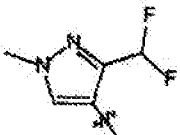
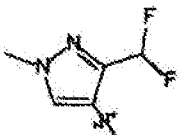
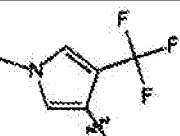
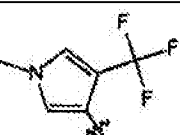
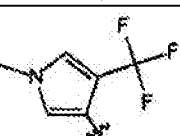
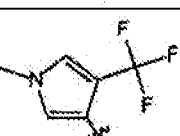
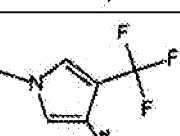
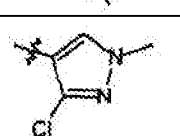


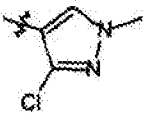
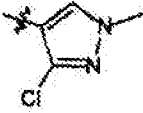
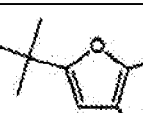
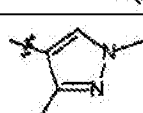
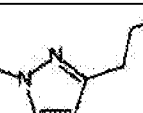
Таблиця 1:

Ex №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
1		S	cPr	H	H	4(4-Cl-фенокси)	430	4,59
2		S	cPr	H	H	2-F-4-(3-Cl-4-F-феніл)	460	4,73
3		S	cPr	H	H	2-Cl-3-CF ₃	406	3,92
4		S	cPr	H	H	2,6-Et ₂	360	4,39
5		S	cPr	H	H	4-OPh	396	4,06
6		S	cPr	H	H	4,4,6-Cl ₃	406	4,42
7		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	376	4,64
8		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	406	4,14
9		S	cPr	H	H	2-Cl-5-CF ₃	406	3,96

10		S	cPr	H	Pr	2,4-Cl ₂	414	4,97
11		S	cPr	H	H	2-cHex	386	5,17
12		S	cPr	H	H	2-I	430	3,68
13		S	cPr	H	H	2,4,6-Br ₂		4,86
14		S	cPr	H	H	2-iPr	346	3,89
15		S	cPr	H	Me	2,4-Cl ₂	386	4,14
16		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	388	4,06
17		S	cPr	H	Me	3-OBn	424	4,36
18		S	cPr	H	H	4-(2,4-Cl ₂ -фенокси)	464	5
19		S	cPr	H	Me	2,5-Cl ₂	386	4,04
20		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	434	
21		S	cPr	H	H	2-CH ₂ SiMe ₃	390	
22		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl		3,99
23		S	cPr	H	H	2-IBu	360	
24		S	cPr	H	H	2-IPn	374	

25		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	424	
26		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	434	
27		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	406	
28		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	420	4,54
29		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	438	
30		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃	420	
31		S	cPr	H	H	2-Br	400	3,46
32		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	404	4,01
33		S	cPr	H	H	3-OBn	428	4,06
34		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	424	3,71
35		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	424	4,09
36		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	424	4,01
37		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	394	4,49

38		S	cPr	H	H	H	322	
39		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	390	
40		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	452	
41		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-I	476	
42		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl		3,89
43		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	452	
44		S	cPr	H	H	2-Cl-4,5-метилendiоксо	417	4,01
45		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂ -4-OCF ₃	492	4,9
46		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	443	4,67
47		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	443	4,94
48		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	409	4,95
49		S	cPr	H	Me	3,5-Cl ₂		4,49

50		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	408	3,83
51		S	cPr	H	H	2-I		3,73
52		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃		4,49
53		S	cPr	H	H	2-I	426	3,53
54		S	cPr	H	H	2-I	454	5,95
55		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂		3,71
56		S	cPr	H	Me	2,6-Cl ₂	396	4,39

Наступні приклади ілюструють одержання та ефективність сполук формули (I) згідно з винаходом, але не обмежують його.

Приклад одержання:

Загальний приклад одержання: тіонування амідів Формули (I) в апараті Chemspeed

В 13 мл посудину Chemspeed зважують 0,27 ммоль пентасульфід фосфору (P₂S₅). Додають 3 мл 0,18 молярного розчину амідів (I) (0,54 ммоль) в діоксані і суміш нагрівають зі зворотним холодильником протягом двох годин. Потім температуру понижують до 80 °C і додають 2,5 мл води. Суміш нагрівають при 80 °C ще годину. Потім додають 2 мл води і реакційну суміш екстрагують двічі 4 мл дихлорметану. Розчинники видаляють і сире тіоамідне похідне аналізують за допомогою LCMS та NMR. Недостатньо чисті сполуки додатково очищують препаративним LCMS.

Приклад А: Тест in vivo на *Alternaria brassicae* (плямистість листя хрестоцвітних)

Досліджувані активні інгредієнти готували шляхом гомогенізації в суміші ацетон/твін/вода. Потім суспензію розводили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини редису (виду Pernot), які висіювали в 50/50 торфянисто-пуцолановому субстраті в вихідних чашках та вирощували при 18-20 °C, обробляли на стадії сім'ядолі розпиленням активною сполукою, приготовленою, як описано вище.

Рослини, використані для контролю, обробляли сумішшю ацетон/твін/вода, яка не містить активний матеріал.

Через 24 год. рослини заражували оприскуванням їх водною суспензією спорів *Alternaria brassicae* (40,000 спор на см³). Спори збирали з 12-13 денної культури. Заражені рослини редису інкубували протягом 6-7 днів при 18 °C у вологій атмосфері.

На 6-7 день після зараження проводили якісний відбір в порівнянні з контрольними рослинами.

В цих умовах високий захист (принаймні 70 %) спостерігався при дозі 500 ppm з наступними сполуками: 1, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 14, 16, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 42, 43 та 50.

Приклад В: Тест in vivo на *Pyrenophora teres* (сітчаста плямистість ячменю)

Досліджувані активні інгредієнти готували шляхом гомогенізації в суміші ацетон/твін/ДМСО, потім суспензію розводили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини ячменю (виду Express), які висіювали в 50/50 торфянисто-пуцолановому субстраті в вихідних чашках та вирощували при 12 °C, обробляли на стадії 1 листа (висота 10 см) розпиленням активної сполуки, приготовленої, як описано вище. Рослини, використані для контролю, обробляли сумішшю ацетон/твін/ДМСО/вода, яка не містить активний матеріал.

Через 24 год. рослини заражували оприскуванням їх водною суспензією спорів *Pyrenophora teres* (12,000 спор на мл). Спори збирали з 12-денної культури. Заражені рослини ячменю інкубували протягом 24 годин при 20 °C

та 100 % відносній вологості, а потім протягом 12 днів при 80 % відносній вологості.

На 12 день після зараження проводили якісний відбір в порівнянні з контрольними рослинами.

В цих умовах високий (принаймні 70 %) або повний захист спостерігався при дозі 500 ppm з наступними сполуками: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 42, 43, 44, 46, 50, 51, 52, 53 та 55.

Приклад С: Тест in vivo на *Sphaerotheca fuliginea* (справжня мучниста роса кабакових)

Досліджувані активні інгредієнти готували шляхом гомогенізації в суміші ацетон/твін/вода. Потім суспензію розводили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини корнішону (виду *Vert petit de Paris*) в вихідних чашках, які висіювали в 50/50 торфянисто-пуццолановому субстраті та вирощували при 20 °C/23 °C, обробляли на стадії 2 листів розпиленням водною суспензією, описаною вище. Рослини, використані для контролю, обробляли водним розчином, який не містить активний матеріал.

Через 24 год. рослини заражували їх оприскуванням водною суспензією спорів *Sphaerotheca fuliginea* (100 000 спор на мл). Спори збирали з заражених рослин. Заражені рослини корнішону інкубували в умовах приблизно 20 °C/25 °C та 60/70 % відносній вологості.

На 21 день після зараження проводили якісний відбір (% ефективності) в порівнянні з контрольними рослинами.

В цих умовах високий (принаймні 70 %) або повний захист спостерігався при дозі 500 ppm з наступними сполуками: 3, 4, 5, 6, 8, 9, 10, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 28, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 50, 51, 52, 53, 55 та 56.

Приклад D: Тест in vivo на *Mycosphaerella graminicola* (плямистість листя пшениці)

Досліджувані активні інгредієнти готували шляхом гомогенізації в суміші ацетон/твін/ДМСО, потім суспензію розводили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини пшениці (виду *Scirion*), висіяні в 50/50 торфянисто-пуццолановому субстраті в вихідних чашках та вирощені при 12 °C, обробляли на стадії 1 листа (висота 10 см) розпиленням активної сполуки, приготовленої, як описано вище. Рослини, використані для контролю, обробляли сумішшю ацетон/твін/ДМСО/вода, яка не містить активний матеріал.

Через 24 год. рослини заражували їх оприскуванням водною суспензією спорів *Mycosphaerella graminicola* (500,000 спор на мл). Спори збирали з 7- денної культури. Заражені рослини ячменю інкубували протягом 72 годин при 18 °C та 100 % відносній вологості, а потім протягом 21-28 днів при 90 % відносній вологості.

На 21-28 день після зараження проводили якісний відбір (% ефективності) в порівнянні з контрольними рослинами.

В цих умовах високий (принаймні 70 %) або повний захист спостерігався при дозі 500 ppm з наступними сполуками: 1, 2, 4, 6, 7, 10, 11, 12, 14, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 31, 32, 34, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 46, 53, 55 та 56.

Приклад ефективності E: Тест in vivo на *Puccinia recondite* f.Sp. *tritici* (бура іржа пшениці)

Досліджувані активні інгредієнти готували шляхом гомогенізації в суміші ацетон/твін/ДМСО, потім суспензію розводили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини пшениці (виду *Scirion*), висіяні в 50/50 торфянисто-пуццолановому субстраті в вихідних чашках та вирощені при 12 °C, обробляли на стадії 1 листа (висота 10 см) розпиленням активної сполуки, приготовленої, як описано вище. Рослини, використані для контролю, обробляли сумішшю ацетон/твін/ДМСО/вода, яка не містить активний матеріал.

Через 24 год. рослини заражували їх оприскуванням водною суспензією спорів *Puccinia recondite* (100,000 спор на мл). Спори збирали з 10-денної зараженої пшениці і суспендували у воді, що містить 2,5 мл/л твіну 80 10 %. Заражені рослини пшениці інкубували протягом 24 години при 20 °C та 100 % відносній вологості, а потім протягом 10 днів при 20 °C та 70 % відносній вологості. На 10 день після зараження проводили якісний відбір в порівнянні з контрольними рослинами. В цих умовах високий (принаймні 70 %) або повний захист спостерігався при дозі 500 ppm з наступними сполуками: 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 14, 16, 17, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 29, 32, 34, 36, 37, 38, 39, 42, 50, 51 та 52.