



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2006135123/04, 03.03.2005

(30) Конвенционный приоритет:  
05.03.2004 EP 04356031.7

(43) Дата публикации заявки: 10.04.2008 Бюл. № 10

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:  
05.10.2006(86) Заявка РСТ:  
EP 2005/003284 (03.03.2005)(87) Публикация РСТ:  
WO 2005/089547 (29.09.2005)

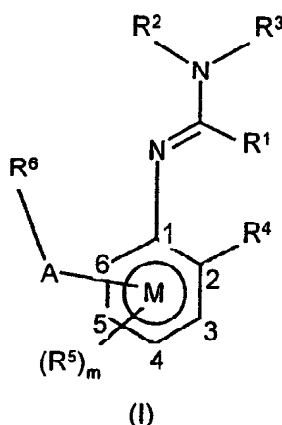
Адрес для переписки:  
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой, рег.№ 513

(71) Заявитель(и):  
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС СА (FR)(72) Автор(ы):  
ЛАБУРДЕТТ Жильбер (FR)

## (54) ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ, ВКЛЮЧАЮЩАЯ АРИЛАМИДНОЕ ПРОИЗВОДНОЕ И ИЗВЕСТНЫЕ ФУНГИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

## (57) Формула изобретения

1. Фунгицидная композиция, включающая  
А) ариламидное производное формулы (I):



где

R<sup>1</sup> представляет собой алкил, алкенил, алкинил, одновалентную карбоциклическую или гетероциклическую группу, причем каждая из этих групп может быть замещенной, или водород;

R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup>, которые могут быть одинаковыми или разными, представляют собой группы,

определенные для R<sup>1</sup>; циано; ацил; -OR<sup>a</sup> или -SR<sup>a</sup>, где R<sup>a</sup> представляет собой алкил, алкенил, алкинил, одновалентную карбоциклическую или гетероциклическую группу, причем каждая из этих групп может быть замещенной, или R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> или R<sup>2</sup> и R<sup>1</sup> могут вместе с атомами, соединяющими их, могут образовывать цикл, который может быть замещенным;

R<sup>4</sup> представляет собой алкил, алкенил, алкинил, одновалентную карбоциклическую или гетероциклическую группу, причем каждая из указанных групп может быть замещенной, гидроксильную группу; меркапто; азидо; нитро; галоген; циано; необязательно замещенный ацил, amino; цианато; тиоцианато; -SF<sub>5</sub>; -OR<sup>a</sup>; -SR<sup>a</sup> или -Si(R<sup>a</sup>)<sub>3</sub>;

m=от 0 до 3;

необязательная R<sup>5</sup> группа или необязательные R<sup>5</sup> группы, которые могут быть одинаковыми или разными, принимают значения, определенные выше для R<sup>4</sup>;

R<sup>6</sup> необязательно замещен одновалентной карбоциклической группой; и

A представляет собой одинарную связь, -O-, -S(O)<sub>n</sub>-, -NR<sup>9</sup>-, -CR<sup>7</sup>=CR<sup>7</sup>-, -C≡C-, -A<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>1</sup>-, -O-(A<sup>1</sup>)<sub>k</sub>-O-, -O-(A<sup>1</sup>)<sub>k</sub>-, -A<sup>3</sup>-, -A<sup>4</sup>-, -A<sup>1</sup>O-, -A<sup>1</sup>S(O)<sub>n</sub>-, -A<sup>2</sup>-, OA<sup>2</sup>-, -NR<sup>9</sup>A<sup>2</sup>-, -OA<sup>2</sup>-A<sup>1</sup>-, -OA<sup>2</sup>-C(R<sup>7</sup>)=C(R<sup>8</sup>)-, -S(O)<sub>n</sub>A<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-C(R<sup>8</sup>)=N-N=CR<sup>8</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-C(R<sup>8</sup>)=N-X<sup>2</sup>-X<sup>3</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-A<sup>3</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-N(R<sup>9</sup>)-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-X-CH<sub>2</sub>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-A<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-CH<sub>2</sub>X-, -A<sup>1</sup>-A<sup>4</sup>-C(R<sup>8</sup>)=N-X<sup>2</sup>-X<sup>3</sup>-X<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-X-C(R<sup>8</sup>)=N-, -A<sup>1</sup>-X-C(R<sup>8</sup>)=N-N=CR<sup>8</sup>-, -A<sup>1</sup>-X-C(R<sup>8</sup>)=N-N(R<sup>9</sup>)-, -A<sup>1</sup>-X-A<sup>3</sup>-X<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-O-A<sup>3</sup>-, -A<sup>1</sup>-O-C(R<sup>7</sup>)=C(R<sup>8</sup>)-, -A<sup>1</sup>-O-N(R<sup>9</sup>)-A<sup>2</sup>-N(R<sup>9</sup>)-, -A<sup>1</sup>-O-N(R<sup>9</sup>)-A<sup>2</sup>-, -A<sup>1</sup>-N(R<sup>9</sup>)-A<sup>2</sup>-N(R<sup>9</sup>)-, A<sup>1</sup>-N(R<sup>9</sup>)-A<sup>2</sup>-, -A<sup>1</sup>-N(R<sup>9</sup>)-N=C(R<sup>8</sup>)-, -A<sup>3</sup>-A<sup>1</sup>-, -A<sup>4</sup>-A<sup>3</sup>-, -A<sup>2</sup>-NR<sup>9</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>2</sup>-X<sup>1</sup>-, -A<sup>1</sup>-A<sup>1</sup>-A<sup>2</sup>-X<sup>1</sup>-, -O-A<sup>2</sup>-N(R<sup>9</sup>)-A<sup>2</sup>-, -CR<sup>7</sup>=CR<sup>7</sup>-A<sup>2</sup>-X<sup>1</sup>-, -C≡C-A<sup>2</sup>-X<sup>1</sup>-, -N=C(R<sup>8</sup>)-A<sup>2</sup>-X<sup>1</sup>-, -C(R<sup>8</sup>)=N-N-C(R<sup>8</sup>)-, -C(R<sup>8</sup>)-N=N(R<sup>9</sup>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>8</sup>)- или -X-A<sup>2</sup>-N(R<sup>9</sup>), где

n=0, 1 или 2,

k=от 1 до 9,

A<sup>1</sup>=-CHR<sup>7</sup>-,

A<sup>2</sup>=-C(=X)-,

A<sup>3</sup>=-C(R<sup>8</sup>)=N-O-,

A<sup>4</sup>=-O-N=C(R<sup>8</sup>)-,

X=O или S,

X<sup>1</sup>=O, S, NR<sup>9</sup> или одинарная связь,

X<sup>2</sup>=O, S, NR<sup>9</sup> или одинарная связь,

X<sup>3</sup>=водород, -C(=O)-, -SO<sub>2</sub>- или одинарная связь,

R<sup>7</sup>, которые могут быть одинаковыми или разными, каждый представляет собой необязательно замещенный алкил, циклоалкил или фенил, причем каждая из указанных групп может быть замещенной, водород, галоген, циано или ацил;

R<sup>8</sup>, которые могут быть одинаковыми или разными, каждый представляет собой алкил, алкенил, алкинил, алкокси, алкилтио, причем каждая из указанных групп может быть замещенной, одновалентную карбоциклическую или гетероциклическую группу, которая может быть необязательно замещенной, или водород;

R<sup>9</sup>, которые могут быть одинаковыми или разными, каждый представляет собой необязательно замещенный алкил, одновалентную карбоциклическую или гетероциклическую группу, которая может быть необязательно замещенной, или ацил; или две R<sup>9</sup> группы вместе с атомами, соединяющими их, могут образовывать 5-7-членный цикл;

группа, представленная справа от связи A, связана с R<sup>6</sup>; или -A-R<sup>6</sup> и R<sup>5</sup> вместе с бензольным кольцом M образуют систему необязательно замещенных конденсированных циклов;

и необязательные оптические и/или геометрические изомеры, таутомеры и кислотно- и основно-аддитивные соли, которые являются агрономически приемлемыми, или их производные формулы (I); и их смеси; и

В) фунгицидное соединение, выбранное из следующих фунгицидов: актинолат;

алдиморф; андоприм; боскалид; капсимицин; карвон; клозилакон; цифлуфенамид; дикломезин; флуморф; флуоксастробин; йодокарб; ирумамицин; метрафенон; милдиомицин; миклобутанил; орисастробин; оксолиновая кислота; окспоконазол; оксифентиин; паклобутразол; пентиопирад; пикобензамид; пропаносин-натрий; проквиназид; протиоконазол; пирролнитрин; СУ-18, известный также как натрий-тетратио-(пероксокарбонат); теклофлатам; тиадинил; трицикламид; униканазол; цис-1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклогептанол; N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-формиламино-2-гидроксибензамид; N-(6-метокси-3-пиридинил)циклопропанкарбоксамид; N-бутил-8-(1,1-диметилэтил)-1-оксаспиро[4.5]декан-3-амин; метил-1-(2,3-дигидро-2,2-диметил-1H-инден-1-ил)-1H-имидазол-5-карбоксилат; метил-2-[[[циклопропил[(4-метоксифенил)имино]метил]тио]метил]-альфа-(метоксиметилен)бензолацетат; метил-2-[2-[3-(4-хлорфенил)-1-метилаллилиденаминооксиметил]фенил]-3-метоксиакрилат; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропинил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид; 1-(1-нафталинил)-1H-пиррол-2,5-дион; 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пиридин; 2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-4-[[[1-(3-(трифторметил)фенил)этилиден]амино]окси]метил]фенил]-3H-1,2,3-триазол-3-он; 2-амино-4-метил-N-фенил-5-тиазолкарбоксамид; 2-хлор-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1H-инден-4-ил)-3-пиридинкарбоксамид; 3,4,5-трихлор-2,6-пиридиндикарбонитрил; 3-[(3-бром-6-фтор-2-метил-1H-индол-1-ил)сульфонил]-N,N-диметил-1H-1,2,4-триазол-1-сульфонамид; и их смеси.

2. Композиция по п. 1, включающая соединение (A) формулы (I), где

$R^1$  представляет собой алкил, алкенил или алкинил, причем каждая из указанных групп может быть замещенной алкокси, галогеналкокси, алкилтио, галоген или фенил, необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, алкилтио или галогеном, или водород;

$R^2$  и  $R^3$ , которые могут быть одинаковыми или разными, принимают значения, определенные выше для  $R^1$ , или представляют собой алкокси, алкоксиалкил, бензилокси, циано или алкилкарбонил;

$R^4$  представляет собой алкил, алкенил или алкинил, причем каждая из указанных групп может быть замещенной алкоксигруппой, галогеналкокси, алкилтио, галоген или фенил, необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, алкилтиогруппой или галогеном; гидроксильную группу; галоген; циано; ацил (предпочтительно  $-C(=O)R^C$ ,  $-C(=S)R^C$  или  $-S(O)_pR^C$ , где  $R^C$  представляет собой алкил, галогеналкил, алкокси, галогеналкокси, алкилтио, амин, моноалкиламин, диамиламин или фенил, необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси или алтилтиогруппой;

$m=0$  или 1;

$R^5$ , когда присутствует, принимает значения, определенные выше для  $R^4$ ,

A представляет собой одинарную связь,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-NR^9-$ ,  $-CHR^7-$  или  $-O-CHR^7-$ ,

$R^9$ , когда присутствует, представляет собой алкил, алкенил или алкинил, причем каждая из указанных групп может быть замещена алкоксигруппой, галогеналкокси, алкилтио, галоген или фенил, необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, алкилтио или галогеном, или представляет собой водород;

$R^7$  принимает значения, приведенные выше для  $R^9$ , или представляет собой гидроксил; галоген; циано; ацил; алкокси; галогеналкокси или алкилтиогруппу;

A присоединен в положении 4 бензильного цикла M и

$R^6$  представляет собой фенил или ароматический гетероцикл, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, которые могут быть одинаковыми или разными и которые могут быть выбраны из следующего перечня: гидроксильная группа; галоген; циано; ацил (предпочтительно  $-C(=O)R^C$ ,  $-C(=S)R^C$  или  $-S(O)_pR^C$ , где  $R^C$ =алкил, галогеналкил, алкокси, галогеналкокси, алкилтио или фенил, необязательно замещенным алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси или алкилтио); амин; алкиламин; диалкиламин; алкил, галогеналкил,  $R^aO$ -алкил, ацилоксиалкил, цианоксиалкил, алкокси; галогеналкокси; алкилтио; циклоалкил (предпочтительно циклогексил или циклопентил),

необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси или алкилтиогруппой; и бензил, необязательно замещенный алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси или алкилтиогруппой.

3. Композиция по п. 1 или 2, включающая соединение (A) формулы (I), где:

$R^1=H$ ;

$R^2=C1-C6$  алкил;

$R^3=C1-C6$  алкил;

$R^4=C1-C6$  алкил;

$R^5=C1-C6$  алкил и  $R^5$  присоединен к атому углерода в положении C5 бензильного цикла M, где  $m=1$ ;

A присоединен к атому углерода в положении C4 бензильного цикла M и представляет собой -O-;

$R^6$ =арил, необязательно замещенный, по меньшей мере, одним алкилом и/или, по меньшей мере, одним галогеном.

4. Композиция по п. 3, включающая соединение (A) формулы (I), где:

$R^2$ =метил;

$R^3$ =этил;

$R^4$ =метил;

$R^5$ =метил и  $R^5$  присоединен к атому углерода в положении C5 бензильного цикла M, где  $m=1$ ;

$R^6$ =бензил, замещенный, по меньшей мере, одним алкилом и/или, по меньшей мере, одним галогеном

5. Композиция по п.4, где соединение (A) представляет собой N-этил-N-метил-N'-[4-(хлор-3-трифторметилфенокси)-2,5-ксилил]формаимидин и N-этил-N-метил-N'-[4-(фтор-3-трифторметилфенокси)-2,5-ксилил]формаимидин и их возможные таутомеры и кислотные и основно-аддитивные соли, которые являются агрономически приемлемыми.

6. Композиция по п.5, где соединение (B) представляет собой протиоконазол.

7. Композиция по п.1, где соединение (B) представляет собой протиоконазол.

8. Композиция по п.5, где соединение (B) представляет собой флуоксастробин.

9. Композиция по п.1, где (B) представляет собой флуоксастробин.

10. Композиция по п.1, где соединение (A) представляет собой N-этил-N-метил-N'-[4-(хлор-3-трифторметилфенокси)-2,5-ксилил]формаимидин и соединение (B) представляет собой флуоксастробин или протиоконазол.

11. Композиция по п.1, где массовое соотношение соединения (A) и соединения (B) составляет  $0,001 \leq A/B \leq 500$ .

12. Композиция по п.2, где массовое соотношение соединения (A) и соединения (B) составляет  $0,001 \leq A/B \leq 500$ .

13. Композиция по п.3, где массовое соотношение соединения (A) и соединения (B) составляет  $0,001 \leq A/B \leq 500$ .

14. Композиция по п.4, где массовое соотношение соединения (A) и соединения (B) составляет  $0,001 \leq A/B \leq 500$ .

15. Композиция по п.11, где массовое соотношение составляет  $0,01 \leq A/B \leq 10$ .

16. Композиция по п.10, где массовое соотношение между соединением (A) и соединением (B) составляет  $0,05 \leq A/B \leq 5$ .

17. Способ борьбы с фитопатогенными грибами сельскохозяйственных культур, отличающийся тем, что агрономически эффективное и, по существу, нефитотоксичное количество фунгицидной композиции по пп.1-16 наносится на почву, где растения выращиваются или могут выращиваться, на листья, и/или на плоды растений, или на семена растений.

18. Способ по п.15, где доза соединения (A) и соединения (B) составляет от 1 до 2000 г/га.

19. Способ по п.18, где доза соединения (A) и соединения (B) составляет от 5 до 700 г/га.

20. Способ по пп.17-19 для защиты зерновых культур (пшеницы, ячменя, маиса, риса) и

овощных культур (фасоли, лука, тыквенных, капусты, картофеля, томатов, сладкого стручкового перца, капусты, гороха, салата-латука, сельдерея, цикория), плодово-ягодных культур (растений земляники, растений малины), древесных культур (яблонь, грушевых деревьев, вишневых деревьев, женьшеня, лимонных деревьев, кокосовых пальм, кария пекана, какао-деревьев, ореховых деревьев, каучуконосных деревьев, оливковых деревьев, тополей, банановых деревьев), виноградной лозы, подсолнечника, свеклы, табака и декоративных культур, люцерны, соевых бобов, рыночных огородных культур, травяного покрова, древесной растительности или садовых растений.

21. Способ по п.19 для борьбы с болезнями зерновых, выбранных из настоящей мучнистой росы, септориозов и бурой ржавчины.

R U 2 0 0 6 1 3 5 1 2 3 A

R U 2 0 0 6 1 3 5 1 2 3 A