



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **110703** (13) **C2**
(51) МПК (2016.01)
C07F 7/08 (2006.01)
A01N 55/10 (2006.01)
A01P 3/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: а 2012 14919	(72) Винахідник(и): Бентін Юрген (DE), Дамен Петер (DE), Десборде Філіппе (FR), Гарі Стефані (FR), Гросжан-Курное Марі-Клер (FR), Хадано Хіроюкі (JP), Мейсснер Рут (DE), Рама Рейчел (FR), Рінолфі Філіппе (FR), Вачендорфф-Ньюманн Ульрік (DE)
(22) Дата подання заявки: 01.06.2011	(73) Власник(и): БАЙЕР КРОПСАЙНС АГ, Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, Germany (DE)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 10.02.2016	(74) Представник: Льгова Майя Миколаївна, реєстр. №12
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 10356018.1, 61/368,007	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: ZAKAI U.I. et al. Synthesis of lipophilic sila derivatives of N-acetylcysteineamide, a cell permeating thiol// APPLIED ORGANOMETALLIC CHEMISTRY, vol. 24, no. 3, March 2010, pp. 189-192 Liao R. et al. Study on organo-silicon compounds with biological activity. (X). Synthesis of N-hydroxycarbonyl-N-dimethylphenyldimethylsilylmethylene-2-furamide and its biological activity//GAODENG XUEXIAO HUAXUE XUEBAO, vol. 11, no. 10, 1990, pp. 1072-1075
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 03.06.2010, 27.07.2010	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: EP, US	
(41) Публікація відомостей про заявку: 11.02.2013, Бюл.№ 3	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.02.2016, Бюл.№ 3	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/EP2011/059024, 01.06.2011	

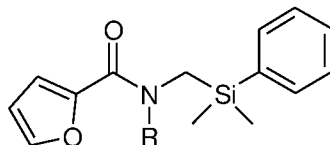
(54) ФУНГІЦИДНІ ПОХІДНІ N-[(ТРИЗАМІЩЕНИЙ СИЛІЛ)МЕТИЛ]-КАРБОКСАМІДУ**(57) Реферат:**

Винахід стосується фунгіцидного N-[(тризаміщений силіл)метил]карбоксаміду або його тіокарбоксамідних похідних, способу їх одержання та проміжних сполук для їх одержання, їх застосування як фунгіцидів, зокрема у вигляді фунгіцидних композицій, та способів боротьби з фітопатогенними грибами рослин із застосуванням цих сполук або їх композицій.

UA 110703 C2

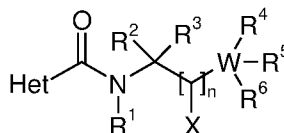
Цей винахід стосується фунгіцидного N-[(тризаміщенийсиліл)метил] карбоксаміду або його тіокарбоксамідної похідної, способу їх одержання та проміжних сполук для їх одержання, їх застосування як фунгіцидів, зокрема у вигляді фунгіцидних композицій, та способів боротьби з фітопатогенними грибами рослин із застосуванням цих сполук або їх композицій.

У публікації Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5 [Chemical Abstracts AN115:49790] загалом охоплені деякі фунгіцидні N-[(диметилфенілсиліл)метил]-2-фурилкарбоксамідні похідні у такій формулі:



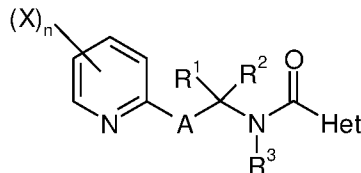
де R може означати різні замісники, серед яких алкільна група або циклогексильна група. Однак, цей документ не розкриває сполук, в яких 2-фурильне кільце або фенільне кільце може бути заміщене або замінене. Крім того, цей документ не розкриває будь-якої сполуки, що включає циклопропільну групу або атом водню, прикріплені до атому азоту карбоксамідного залишку.

В міжнародній заявці на винахід WO-2007/1039615 загалом охоплені деякі фунгіцидні N-[(тріалкілсиліл)алкіл] карбоксамідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



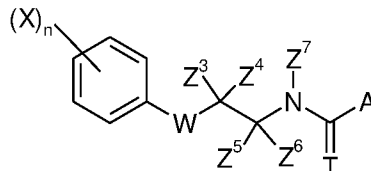
де Het може означати 5-членне гетероциклічне кільце, n може означати від 2 до 4, R¹ може означати атом водню, C₁-C₆-алкільну групу або C₃-C₇-циклоалкільну групу, W може означати атом кремнію, X і R³ може означати атом водню або C₁-C₆-алкільну групу, R², R⁴, R⁵ і R⁶ можуть означати різні замісники, серед яких C₁-C₆-алкільна група. Однак, цей документ не розкриває сполук, в яких n може означати 0. Крім того, цей документ не розкриває будь-якої сполуки, в якій одним із трьох замісників R⁴, R⁵ або R⁶ може бути (гетеро)ароматичне кільце.

В міжнародній патентній заявці WO-2008/081011 загалом охоплені деякі фунгіцидні N-[(діалкіл-2-піридилсиліл)метил] карбоксамідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



де Het може означати 5-членне гетероциклічне кільце, A може означати групу SiR⁴R⁵, R³ може означати атом водню, C₁-C₆-алкільну групу або C₃-C₇-циклоалкільну групу, R¹ і R² можуть означати різні замісники, серед яких атом водню або C₁-C₆-алкільна група, і R⁴ та R⁵ можуть означати C₁-C₆-алкільну групу. Однак, цей документ не розкриває сполук, в яких частка 2-піридину може бути заміщена фенільною групою. Крім того, в цьому документі не має чіткого розкриття будь-якої сполуки, в якій A може бути діалкілсилільною групою.

В міжнародній патентній заявці WO-2010/012795 загалом охоплені деякі фунгіцидні N-[(діалкіл-2-фенілсиліл)етил] карбоксамідні похідні у широкому розкритті численних сполук такої формули:



де A може означати 5-членне гетероциклічне кільце, T може означати атом кисню або атом сірки, W може означати групу SiZ¹Z², Z⁷ може означати C₃-C₇-циклоалкільну групу, Z¹ і Z² можуть означати C₁-C₈-алкільну групу та Z³, Z⁴, Z⁵ і Z⁶ можуть означати різні замісники, серед яких атом водню або C₁-C₈-алкільна група. Однак, у цьому документі не розкриті сполуки, в яких група SiZ¹Z² може бути прикріплена до частки (тіо)карбоксаміду унікальною метиленовою групою, або в яких Z⁷ може означати атом водню або C₁-C₆-алкільну групу. Крім того, цей

незаміщений N-(C₁-C₈-алкіл)-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл; арил, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкіл, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-арилалкеніл, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₂-C₈-арилалкініл, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилокси, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; арилсульфаніл, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; ариламіно, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкілокси, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₈-арилалкілсульфаніл, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними; або C₁-C₈-арилалкіламіно, що може бути заміщений до 6 групами Q, які можуть бути однаковими або різними;

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

- Z¹ і Z² незалежно означають атом водню; атом галогену; ціано; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; або заміщений чи незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбоніл; або Z¹ і Z² означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка може бути заміщена до чотирма C₁-C₈-алкільними групами;

- Z³ і Z⁴ незалежно означають заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл;

- Z⁵ і Z⁶ незалежно означають атом водню; атом галогену; ціано; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; або заміщений чи незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбоніл; або Z⁵ і Z⁶ означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка може бути заміщена до чотирма C₁-C₈-алкільними групами;

- Z⁷ означає атом водню; формільну групу; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; 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, ціано, C₁-C₈-алкілу, C₁-C₈-галогеналкілу, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, C₁-C₈-алкоксикарбонілу, C₁-C₈-галогеналкоксикарбонілу, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, C₁-C₈-алкіламінокарбонілу і ди-C₁-C₈-алкіламінокарбонілу;

- Q незалежно означає атом галогену; ціано; нітро; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (C₁-C₈-алкоксіміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (бензилоксіміно)-C₁-C₈-алкіл;

- R незалежно означає атом водню; атом галогену; нітро; ціано; гідрокси; аміно; сульфаніл; пентафтор-λ⁶-сульфаніл; заміщений або незаміщений (C₁-C₈-алкоксіміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений (бензилоксіміно)-C₁-C₈-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл; C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкеніл; C₂-C₈-галогеналкеніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-галогеналкініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфаніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфініл; C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілсульфоніл; C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений ди-C₁-C₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений C₂-C₈-алкенілокси; заміщений або незаміщений C₃-C₈-алкінілокси; заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл; C₃-C₇-галогенциклоалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений трі(C₁-C₈)алкілсиліл; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбоніл; C₁-C₈-галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкоксикарбоніл; C₁-C₈-галогеналкоксикарбоніл, що має від 1 до 5 атомів

галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкілкарбамоїл; заміщений або незаміщений ди-C₁-C₈-алкілкарбамоїл; фенокси; фенілсульфаніл; феніламіно; бензилокси; бензилсульфаніл; або бензиламіно;

а також її солі, N-оксиди та оптично-активні ізомери.

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

- галоген означає фтор, бром, хлор або йод;
карбокси означає -C(=O)OH;
карбоніл означає -C(=O)-;
карбамоїл означає -C(=O)NH₂;
N-гідроксикарбамоїл означає -C(=O)NHOH;
SO означає сульфоксидну групу;
SO₂ означає сульфонову групу;
- алکیلна група, алкенільна група та алкінільна група, а також частки, що містять ці терміни, можуть бути лінійними або розгалуженими;
- арильна частка, що міститься в арильній групі, арилалکیلній групі, арилалкенільній групі та арилалкінільній групі, а також частки, що містять ці терміни, можуть бути фенільною групою, що може бути заміщена до 5 групами Q, які можуть бути однаковими або різними, нафтильною групою, що може бути заміщена до 7 групами Q, які можуть бути однаковими або різними, або піридинною групою, що може бути заміщена до 4 групами Q, які можуть бути однаковими або різними;
- гетероатом означає сірку, азот або кисень;
- у разі аміногрупи або аміночастки будь-якої іншої амін-вмісної групи, заміщеної двома замісниками, які можуть бути однаковими або різними, два замісники разом з атомом азоту, до якого вони прикріплені, можуть утворювати гетероциклічну групу, краще від 5- до 7-членної гетероциклічну групу, яка може бути заміщена або може включати інші гетероатоми, наприклад, морфоліногрупу або піперидинільну групу;
- якщо не вказано інакше, група або замісник, заміщений відповідно до винаходу, може бути заміщений однією або більше з таких груп або атомів: атом галогену, нітрогрупа, гідроксигрупа, ціаногрупа, аміногрупа, сульфанільна група, пентафтор-λ⁶-сульфанільна група, формільна група, формілоксигрупа, форміламіногрупа, карбамоїльна група, N-гідроксикарбамоїльна група, карбаматна група, (гідроксііміно)-C₁-C₆-алکیلна група, C₁-C₈-алкіл, трі(C₁-C₈-алкіл)силіл-C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-циклоалкіл, трі(C₁-C₈-алкіл)силіл-C₁-C₈-циклоалкіл, C₁-C₈-галогеналкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-галогенциклоалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₂-C₈-алкеніл, C₂-C₈-алкініл, C₂-C₈-алкенілокси, C₂-C₈-алкінілокси, C₁-C₈-алкіламіно, ди-C₁-C₈-алкіламіно, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеналкокси, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілсульфаніл, C₁-C₈-галогеналкілсульфаніл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₂-C₈-алкенілокси, C₂-C₈-галогеналкенілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₃-C₈-алкінілокси, C₃-C₈-галогеналкінілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілкарбоніл, C₁-C₈-галогеналкілкарбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілкарбамоїл, ди-C₁-C₈-алкілкарбамоїл, N-C₁-C₈-алкілоксикарбамоїл, C₁-C₈-алкоксикарбамоїл, N-C₁-C₈-алкіл-C₁-C₈-алкоксикарбамоїл, C₁-C₈-алкоксикарбоніл, C₁-C₈-галогеналкокси-карбоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілкарбонілокси, C₁-C₈-галогеналкілкарбонілокси, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілкарбоніламіно, C₁-C₈-галогеналкілкарбоніламіно, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси, ди-C₁-C₈-алкіламінокарбонілокси, C₁-C₈-алкілоксикарбонілокси, C₁-C₈-алкілсульфініл, C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкілсульфоніл, C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, що має від 1 до 5 атомів галогену, C₁-C₈-алкіламіносульфамойл, ді-C₁-C₈-алкіламіносульфамойл, (C₁-C₆-алкоксііміно)-C₁-C₆-алкіл, (C₁-C₆-алкенілоксііміно)-C₁-C₆-алкіл, (C₁-C₆-алкінілоксііміно)-C₁-C₆-алкіл, 2-окспіролідін-1-іл, (бензилоксііміно)-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₈-алкоксіалкіл, C₁-C₈-галогеналкоксіалкіл, що має від 1 до 5 атомів галогену, бензилокси, бензилсульфаніл, бензиламіно, фенокси, фенілсульфаніл або феніламіно.

Будь-які зі сполук за винаходом можуть існувати в одній або більше формах оптичного або хирального ізомеру залежно від кількості асиметричних центрів у сполуці. Відповідно, винахід однаково стосується всіх оптичних ізомерів та їхніх рацемічних або скалемічних сумішей (термін «скалемічний» позначає суміш енантіомерів у різних пропорціях) та сумішей усіх можливих стереоізомерів в усіх пропорціях. Діастереоізомери та/або оптичні ізомери можуть бути відокремлені способами, які відомі по суті спеціалістові у цій галузі.

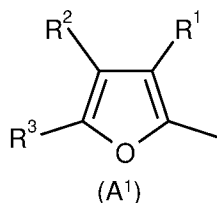
Будь-які зі сполук відповідно до винаходу також можуть існувати в одній або більше формах геометричного ізомеру залежно від кількості подвійних зв'язків у сполуці. Відповідно, винахід однаково стосується всіх геометричних ізомерів та всіх можливих сумішей в усіх пропорціях. Геометричні ізомери можуть бути відокремлені загальними способами, які відомі по суті спеціалістові у цій галузі.

Будь-які зі сполук відповідно до винаходу також можуть існувати в одній або більше формах геометричного ізомеру залежно від відповідного положення (син/анти або цис/транс) замісників В кільця. Відповідно, винахід однаково стосується всіх син/анти (або цис/транс) ізомерів та всіх можливих син/анти (або цис/транс) сумішей в усіх пропорціях. Син/анти (або цис/транс) ізомери можуть бути відокремлені загальними способами, які відомі по суті спеціалістові у цій галузі.

Будь-яка зі сполук формули (I), в якій X означає гідроксигрупу, сульфанільну групу або аміногрупу, може бути знайдена у своїй таутомерній формі, що є наслідком переміщення протону згаданої гідрокси, сульфанільної або аміногрупи. Такі таутомерні форми таких сполук є також частиною цього винаходу. Говорячи більш загально, всі таутомерні форми сполук формули (I), в якій X означає гідроксигрупу, сульфанільну групу або аміногрупу, а також таутомерні форми сполук, які необов'язково можуть бути використані як проміжні сполуки у способах одержання і які будуть визначені при описуванні цих способів, є також частиною цього винаходу.

Кращими сполуками за винаходом є сполуки формули (I), в якій А вибирають з переліку, що складається з:

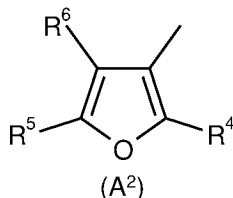
- гетероциклу формули (A¹)



де:

R¹ - R³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; за умови, що принаймні один із замісників R¹ - R³ не є атомом водню;

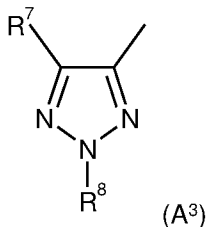
- гетероциклу формули (A²)



де:

R⁴ - R⁶, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

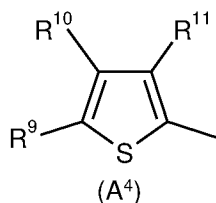
- гетероциклу формули (A³)



де:

R⁷ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси або C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

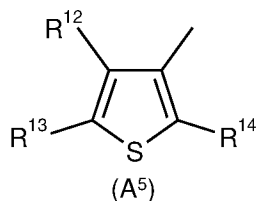
R⁸ означає атом водню або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкіл;
- гетероциклу формули (A⁴)



де:

R⁹ - R¹¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; аміно; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A⁵)

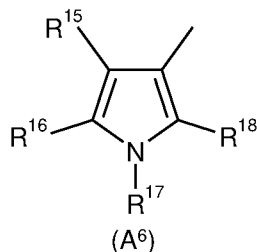


де:

R¹² і R¹³, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; аміно; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

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

- гетероциклу формули (A⁶)



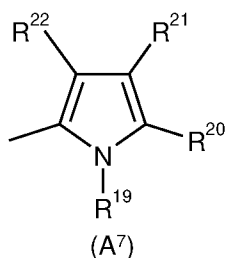
де:

R¹⁵ означає атом водню; атом галогену; ціано; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкіл, 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; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкоксикарбоніл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R¹⁷ означають атом водню або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкіл;

- гетероциклу формули (A⁷)

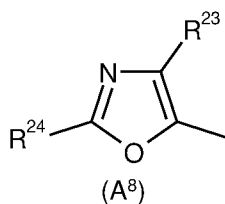


де:

R¹⁹ означає атом водню або C₁-C₅-алкіл,

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

- гетероциклу формули (A⁸)

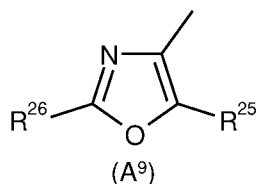


де:

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

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

- гетероциклу формули (A⁹)

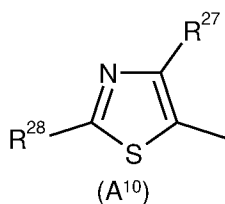


де:

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

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

- гетероциклу формули (A¹⁰)

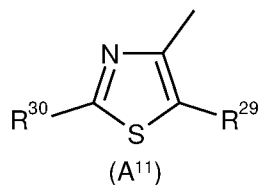


де:

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

R²⁸ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіламіно або заміщений чи незаміщений ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

- гетероциклу формули (A¹¹)

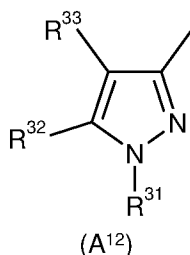


де:

R²⁹ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R³⁰ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіламіно або заміщений чи незаміщений ді(C₁-C₅-алкіл)аміно;

- гетероциклу формули (A¹²)



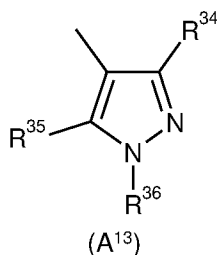
де:

R³¹ означає атом водню або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкіл;

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

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

- гетероциклу формули (A¹³)

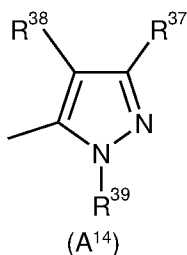


де:

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

R³⁵ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; ціано; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкілсульфаніл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіламіно або заміщений чи незаміщений ди(C₁-C₅-алкіл)аміно;

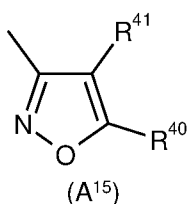
R³⁶ означає атом водню або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкіл;
- гетероциклу формули (A¹⁴)



де:

R³⁷ і R³⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкілсульфаніл;

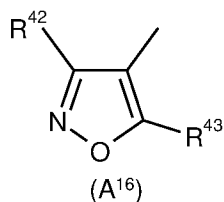
R³⁹ означає атом водню або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкіл;
- гетероциклу формули (A¹⁵)



де:

R⁴⁰ і R⁴¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

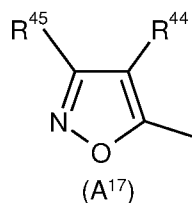
- гетероциклу формули (A¹⁶)



де:

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

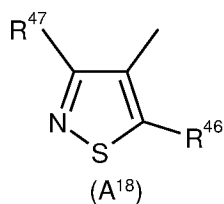
- гетероциклу формули (A¹⁷)



де:

R⁴⁴ і R⁴⁵, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

- гетероциклу формули (A¹⁸)



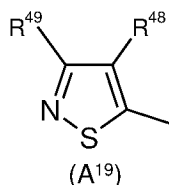
де:

R⁴⁷ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл або C₁-C₅-

галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁴⁶ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або заміщений чи незаміщений C₁-C₅-алкілсульфаніл;

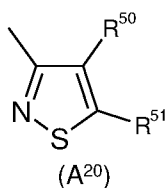
- гетероциклу формули (A¹⁹)



де:

R⁴⁹ і R⁴⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

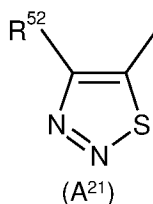
- гетероциклу формули (A²⁰)



де:

R⁵⁰ і R⁵¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкіл; заміщений або незаміщений C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, або C₁-C₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

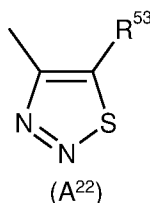
- гетероциклу формули (A²¹)



де:

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

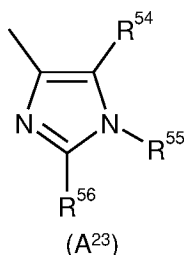
- гетероциклу формули (A²²)



де:

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

- гетероциклу формули (A²³)



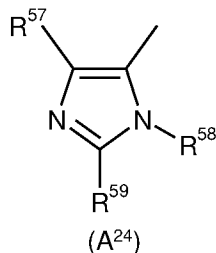
де:

R⁵⁴ і R⁵⁶, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену;

заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл або С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁵⁵ означає атом водню або заміщений чи незаміщений С₁-С₅-алкіл;

- гетероциклу формули (A²⁴)

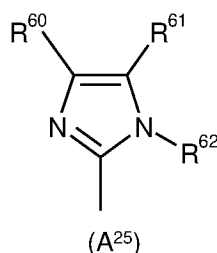


де:

R⁵⁷ і R⁵⁹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл або С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁵⁸ означає атом водню або заміщений чи незаміщений С₁-С₅-алкіл;

- гетероциклу формули (A²⁵)

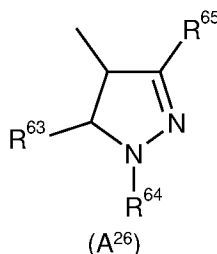


де:

R⁶⁰ і R⁶¹, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл або С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁶² означає атом водню або заміщений чи незаміщений С₁-С₅-алкіл;

- гетероциклу формули (A²⁶)



де:

R⁶⁵ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл; заміщений або незаміщений С₃-С₅-циклоалкіл; С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкокси; заміщений або незаміщений С₂-С₅-алкінілокси або С₁-С₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними;

R⁶³ означає атом водню; атом галогену; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл; ціано; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкокси; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкілсульфаніл; С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; С₁-С₅-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; аміно; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіламіно або ді(С₁-С₅-алкіл)аміно;

R⁶⁴ означає атом водню або заміщений чи незаміщений С₁-С₅-алкіл.

Сполуками за винаходом, яким надають більшу перевагу, є сполуки формули (I), де А вибирають з переліку, що складається з А²; А⁶; А¹⁰ і А¹³, як визначено в цьому описі.

Сполуками за винаходом, яким надають ще більшу перевагу, є сполуки формули (I), де А означає А¹³, R³⁴ означає заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкокси; R³⁵ означає атом водню або атом галогену і R³⁶ означає заміщений або незаміщений С₁-С₅-алкіл.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де Т означає О.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де В означає заміщене чи незаміщене фенольне кільце або заміщене чи незаміщене нафтильне кільце. Навіть ще краще, якщо В означає заміщене або незаміщене фенільне кільце.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де Х незалежно означає атом галогену; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкіл; С₁-С₈-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений трі(С₁-С₈-алкіл)силіл; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкокси або С₁-С₈-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; або де два послідовні замісники Х разом з фенільним кільцем утворюють заміщений або незаміщений 1,3-бензодіоксоліл; 1,2,3,4-тетрагідро-хіноксалініл; 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазиніл; 1,4-бензодіоксаніл; інданіл; 2,3-дигідробензофураніл або індолініл.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де Z¹, Z², Z⁵ і Z⁶ незалежно означають атом водню, заміщений чи незаміщений С₁-С₈-алкіл або заміщений чи незаміщений С₁-С₈-алкокси.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де Z³ і Z⁴ незалежно означають незаміщений С₁-С₈-алкіл. Ще краще, якщо Z³ і Z⁴ незалежно означають незаміщений С₁-С₃-алкіл. Навіть ще краще, якщо Z³ і Z⁴ означають метил.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де Z⁷ означає атом водню, незаміщений С₃-С₇ циклоалкіл або С₃-С₇ 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, С₁-С₈-алкілу, С₁-С₈-галогеналкілу, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними, С₁-С₈-алкокси або С₁-С₈-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними. Ще краще, якщо Z⁷ означає незаміщений С₃-С₇-циклоалкіл; навіть ще краще, якщо Z⁷ означає циклопропіл.

Іншими сполуками за винаходом, яким надають перевагу, є сполуки формули (I), де R незалежно означає атом водню; атом галогену; ціано; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений ди-С₁-С₈-алкіламіно; заміщений або незаміщений трі(С₁-С₈-алкіл)силіл; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкіл; С₁-С₈-галогеналкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкокси; С₁-С₈-галогеналкокси, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкілсульфаніл; аміно; гідроксил; нітро; заміщений або незаміщений С₁-С₈-алкоксикарбоніл; заміщений або незаміщений С₂-С₈-алкінілокси.

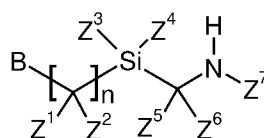
Наведені вище переваги стосовно замісників сполук за винаходом можуть бути поєднані різноманітними способами. Таким чином, ці комбінації ознак, яким надають перевагу, забезпечують підкласи сполук за винаходом. Прикладами таких підкласів кращих сполук за винаходом, які можуть бути поєднані, є:

- кращі ознаки А з кращими ознаками В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки В з кращими ознаками А, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z¹ з кращими ознаками А, В, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z² з кращими ознаками А, В, Z¹, Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z³ з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z⁴ з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z⁵ з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁶, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z⁶ з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁷, Х, Т і R;
- кращі ознаки Z⁷ з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Х, Т і R;
- кращі ознаки Х з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Т і R;
- кращі ознаки Т з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Х і R;
- кращі ознаки R з кращими ознаками А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Т і Х;

У цих комбінаціях кращих ознак замісників сполук за винаходом згадані кращі ознаки можуть також бути вибрані із ще кращих ознак кожного з А, В, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶, Z⁷, Т і Х для утворення найкращих підкласів сполук за винаходом.

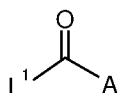
Цей винахід також стосується способу одержання сполуки формули (I).

Отже, відповідно до іншого аспекту цього винаходу забезпечений спосіб Р1 одержання сполуки формули (I), як визначено у цьому описі, в якій Т означає О і який включає введення у реакцію похідної N-[(тризаміщений силіл)метил]аміну формули (II) або однієї з її солей:



(II)

де B, n, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶ і Z⁷ є такими, як визначено в цьому описі, з похідною карбонової кислоти формули (III):



(III)

де A є таким, як визначено тут, а L¹ означає відхідну групу, вибрану з переліку, що складається з атому галогену, гідроксильної групи, -OR^a, -OC(=O)R^a, причому R^a означає заміщений або незаміщений C₁-C₆-алкіл, заміщений або незаміщений C₁-C₆-галоалкіл, бензильну, 4-метоксибензильну або пентафторфенільну групу або групу формули O-C(=O)A; у присутності каталізатора та конденсувального агента, якщо L¹ означає гідроксильну групу, та у присутності кислотної зв'язуючої речовини, якщо L¹ означає атом галогену.

Похідні N-[(тризаміщенийсиліл)метил]аміну формули (II), де Z⁷ означає заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл чи заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл, можуть бути одержані відомими способами, такими як нуклеофільне заміщення (галогенметил)-(діалкіл)арилсилану відповідним первинним аміном (Journal of Organometallic Chemistry («Журнал металоорганічної хімії») (1978), 153, 193). Похідні N-[(тризаміщенийсиліл)метил]аміну формули (II), де Z⁷ означає атом водню, можуть бути одержані відомими способами, такими як нуклеофільне заміщення (галогенметил)-(діалкіл)арилсилану аміаком (Journal of the American Chemical Society («Журнал американського хімічного співтовариства») (1951), 73, 3867) або фталімідом з подальшим зняттям захисту гіdraзином (патентна заявка EP0291787). Крім того, похідні N-[(тризаміщенийсиліл)метил]аміну формули (II), де Z⁷ означає заміщений або незаміщений C₁-C₈-алкіл чи заміщений або незаміщений C₃-C₇-циклоалкіл, можуть бути одержані відомими способами з похідних N-[(тризаміщенийсиліл)метил]аміну формули (II), де Z⁷ означає атом водню, відновлювальним амінуванням альдегідом чи кетоном або нуклеофільним заміщенням галоген(цикло)алкілу (Journal of Organic Chemistry («Журнал органічної хімії») (2005), 70, 8372).

Похідні карбонової кислоти формули (III) можуть бути одержані відомими способами.

У разі, якщо L¹ означає гідроксигрупу, спосіб за цим винаходом проводять у присутності конденсувального агента. Підходящий конденсувальний агент може бути вибраний з необмеженого переліку, що складається з утворювача галоїдної кислоти, такого як фосген, трибромід фосфору, трихлорид фосфору, пентахлорид фосфору, оксид трихлориду фосфору або хлорид тіонілу; утворювача ангідриду, такого як етил хлорформат, метил хлорформат, ізопропіл хлорформат, ізобутил хлорформат або метансульфоніл хлорид; карбодіїмідів, таких як N,N'-дициклогексилкарбодіїмід (DCC), або інших традиційних конденсувальних агентів, таких як пентоксид фосфору, поліфосфорна кислота, N,N'-карбоніл-діїмідазол, 2-етокси-N-етоксикарбоніл-1,2-дигідрокінолін (EEDQ), трифенілфосфін/тетрахлор-метан, гідрат 4-(4,6-диметокси[1.3.5]-тріазин-2-іл)-4-метилморфолінхлориду або бром-тріпіролідін-фосфоній-гексафторфосфат.

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

У разі, якщо L¹ означає атом галогену, спосіб за цим винаходом проводять у присутності кислотної зв'язуючої. Підходящі кислотні зв'язуючі для здійснення способу P1 за винаходом у кожному разі всі є неорганічними та органічними основами, що є звичними для таких реакцій. Перевагу надають застосуванню лужноземельних металів, гідридів лужних металів, гідроксидів лужних металів або алькоксидів лужних металів, таких як гідроксид натрію, гідрид натрію, гідроксид кальцію, гідроксид калію, терт-бутоксид калію або інший гідроксид амонію, лужноземельних карбонатів, таких як карбонат цезію, карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію, ацетатів лужних металів або лужноземельних металів, таких як ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, а також третинних амінів, таких як триметиламін, тріетиламін, діізопропілетиламін, трибутиламін, N,N-диметиламінін, піридин, N-метилпіперидин, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіцикло-нонен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Також можливо працювати за відсутності додаткового конденсувального агента або застосовувати надлишок амінного компонента, так що він одночасно діє як кислотна зв'язуюча речовина.

Відповідно до іншого аспекту за винаходом забезпечений спосіб P2 одержання сполуки формули (I), де Т означає S, починаючи зі сполуки формули (I), в якій Т означає O, який проілюстрований такою схемою реакції:

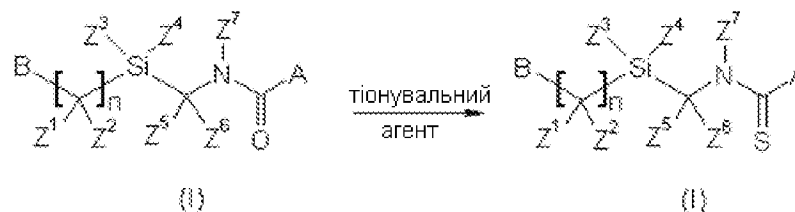


Схема P2

де A, B, n, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 і Z^7 є такими, як визначено тут, у необов'язковій присутності каталітичної або стехіометричної чи більшої кількості основи, такої як неорганічна та органічна оснва. Перевагу надають використанню карбонатів лужних металів, таких як карбонат натрію, карбонат калію, бікарбонат калію, бікарбонат натрію; гетероциклічних ароматичних основ, таких як піридин, піколін, лютидин, колідин; а також третинних амінів, таких як триметиламін, тріетиламін, трибутиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметиламінопіридин або N-метилпіперидин.

Спосіб P2 за винаходом здійснюють у присутності тіонувального агента.

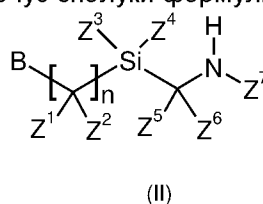
Вихідні амідні похідні формули (I) можуть бути одержані відповідно до способів P1.

Підходящими тіонувальними агентами для здійснення способу P2 за винаходом можуть бути сірка (S), сульфгідрильна кислота (H_2S), сульфід натрію (Na_2S), гідросульфід натрію (NaHS), трисульфід бору (B_2S_3), сульфід біс(діетилалюмінію) ($(\text{AlEt}_2)_2\text{S}$), сульфід амонію ($(\text{NH}_4)_2\text{S}$), фосфорний пентасульфід (P_2S_5), реактив Лавсена (2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,2,3,4-дитіадифосфетан 2,4-дисульфід) або тіонувальний агент на полімерній підложці, як той, що описаний в Journal of the Chemical Society («Журнал хімічного співтовариства»), Perkin 1 (2001), 358.

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

Ще в іншому аспекті цей винахід стосується сполук формули (II), придатних як проміжні сполуки або матеріали для способу одержання за винаходом.

Таким чином, цей винахід забезпечує сполуки формули (II):



де B, n, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 і Z^6 є такими, як визначено тут, і Z^7 означає циклопропільну, циклобутильну, циклопентильну, циклогексильну або циклогептильну групу, за винятком N-{[диметил-(феніл)силіл]метил} циклогексанаміну.

На підставі цього опису, загального знання та доступних публікацій, таких, як, наприклад, в Journal of Organometallic Chemistry («Журнал металоорганічної хімії») (1978), 153, 193 або Journal of Organic Chemistry («Журнал органічної хімії») (2005), 70, 8372, спеціаліст може одержати проміжну сполуку формули (II) за цим винаходом.

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

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

визначена систематичними польовими випробуваннями, можливість проведення яких є доступною для спеціаліста у цій галузі.

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

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

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

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

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

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

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

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

(1) інгібітори біосинтезу ергостерину, наприклад (1.1) альдиморф (1704-28-5), (1.2) азаконазол (60207-31-0), (1.3) бітертанол (55179-31-2), (1.4) бромуконазол (116255-48-2), (1.5) ципроконазол (113096-99-4), (1.6) диклбутразол (75736-33-3), (1.7) дифеноконазол (119446-68-3), (1.8) диніконазол (83657-24-3), (1.9) диніконазол-М (83657-18-5), (1.10) додеморф (1593-77-

7), (1.11) додеморфацетат (31717-87-0), (1.12) епоксиконазол (106325-08-0), (1.13) етаконазол (60207-93-4), (1.14) фенаримол (60168-88-9), (1.15) фенбуконазол (114369-43-6), (1.16) фенгексамід (126833-17-8), (1.17) фенпропідин (67306-00-7), (1.18) фенпропіморф (67306-03-0), (1.19) флукінконазол (136426-54-5), (1.20) флурпримідол (56425-91-3), (1.21) флусилазол (85509-19-9), (1.22) флутріафол (76674-21-0), (1.23) фурконазол (112839-33-5), (1.24) фурконазол-цис (112839-32-4), (1.25) гексаконазол (79983-71-4), (1.26) імазаліл (60534-80-7), (1.27) імазаліл сульфат (58594-72-2), (1.28) імібенконазол (86598-92-7), (1.29) іпконазол (125225-28-7), (1.30) метконазол (125116-23-6), (1.31) міклобутаніл (88671-89-0), (1.32) нафтифін (65472-88-0), (1.33) нуаримол (63284-71-9), (1.34) окспоконазол (174212-12-5), (1.35) паклобутразол (76738-62-0), (1.36) пефуразоат (101903-30-4), (1.37) пенконазол (66246-88-6), (1.38) піпералін (3478-94-2), (1.39) прохлораз (67747-09-5), (1.40) пропіконазол (60207-90-1), (1.41) протіоконазол (178928-70-6), (1.42) пірибутикарб (88678-67-5), (1.43) пірифенокс (88283-41-4), (1.44) хінконазол (103970-75-8), (1.45) симеконазол (149508-90-7), (1.46) спіроксамін (118134-30-8), (1.47) тебуконазол (107534-96-3), (1.48) тербінафін (91161-71-6), (1.49) тетраконазол (112281-77-3), (1.50) тріадимефон (43121-43-3), (1.51) тріадименол (89482-17-7), (1.52) тридеморф (81412-43-3), (1.53) трифлумізол (68694-11-1), (1.54) трифорин (26644-46-2), (1.55) тритиконазол (131983-72-7), (1.56) уніконазол (83657-22-1), (1.57) уніконазол-р (83657-17-4), (1.58) вініконазол (77174-66-4), (1.59) вориконазол (137234-62-9), (1.60) 1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-тріазол-1-іл)циклопентанол (129586-32-9), (1.61) метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл)-1H-імідазол-5-карбоксилат (110323-95-0), (1.62) N'-[5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсиліл)пропокси]феніл]-N-етил-N-метилімідоформамід, (1.63) N-етил-N-метил-N'-[2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-(триметилсиліл)пропокси]феніл] імідоформамід і (1.64) O-[1-(4-метоксифенокси)-3,3-диметилбутан-2-іл] 1H-імідазол-1-карботіоат (111226-71-2);

(2) інгібітори дихального ланцюга в комплексі I або II, наприклад (2.1) біксафен (581809-46-3), (2.2) боскалід (188425-85-6), (2.3) карбоксин (5234-68-4), (2.4) дифлуметорим (130339-07-0), (2.5) фенфурам (24691-80-3), (2.6) флуопірам (658066-35-4), (2.7) флутоланіл (66332-96-5), (2.8) флуксапіроксад (907204-31-3), (2.9) фураметпір (123572-88-3), (2.10) фурмециклокс (60568-05-0), (2.11) ізопіразам (суміш син-епімерного рацемату 1RS,4SR,9RS та анти-епімерного рацемату 1RS,4SR,9SR) (881685-58-1), (2.12) ізопіразам (анти-епімерний рацемат 1RS,4SR,9SR), (2.13) ізопіразам (анти-епімерний енантіомер 1R,4S,9S), (2.14) ізопіразам (анти-епімерний енантіомер 1S,4R,9R), (2.15) ізопіразам (син-епімерний рацемат 1RS,4SR,9RS), (2.16) ізопіразам (син-епімерний енантіомер 1R,4S,9R), (2.17) ізопіразам (син-епімерний енантіомер 1S,4R,9S), (2.18) мепроніл (55814-41-0), (2.19) оксикарбоксин (5259-88-1), (2.20) пенфлуфен (494793-67-8), (2.21) пентіопірад (183675-82-3), (2.22) седаксан (874967-67-6), (2.23) тифлузамід (130000-40-7), (2.24) 1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-3-(трифторметил)-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.25) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетокси)феніл]-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.26) 3-(дифторметил)-N-[4-фтор-2-(1,1,2,3,3,3-гексафторпропокси)феніл]-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід, (2.27) N-[1-(2,4-дихлорфеніл)-1-метоксипропан-2-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід (1092400-95-7) (WO 2008148570), (2.28) 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-[4-(трифторметил)піридин-2-іл]окси)феніл]етил]хіназолін-4-амін (1210070-84-0) (WO2010025451) і (2.29) N-[9-(дихлорметил)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафтален-5-іл]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід;

(3) інгібітори дихального ланцюга в комплексі III, наприклад (3.1) аметоктрадин (865318-97-4), (3.2) амисульбром (348635-87-0), (3.3) азоксистробін (131860-33-8), (3.4) ціазофамід (120116-88-3), (3.5) коуметоксистробін (850881-30-0), (3.6) коумоксистробін (850881-70-8), (3.7) димоксистробін (141600-52-4), (3.8) енестроурин (238410-11-2) (WO 2004/058723), (3.9) фамоксадон (131807-57-3) (WO 2004/058723), (3.10) фенамідон (161326-34-7) (WO 2004/058723), (3.11) феноксистробін (918162-02-4), (3.12) флуоксастробін (361377-29-9) (WO 2004/058723), (3.13) крезоксим-метил (143390-89-0) (WO 2004/058723), (3.14) метоміностробін (133408-50-1) (WO 2004/058723), (3.15) оризастробін (189892-69-1) (WO 2004/058723), (3.16) пікоксистробін (117428-22-5) (WO 2004/058723), (3.17) піраклостробін (175013-18-0) (WO 2004/058723), (3.18) піраметостробін (915410-70-7) (WO 2004/058723), (3.19) піраоксистробін (862588-11-2) (WO 2004/058723), (3.20) пірибенкарб (799247-52-2) (WO 2004/058723), (3.21) триклопірикарб (902760-40-1), (3.22) трифлуксистробін (141517-21-7) (WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпіримідин-4-іл]окси]феніл)-2-(метоксііміно)-N-метилетанамід (WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(метоксііміно)-N-метил-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден]аміно]окси]метил]феніл)етанамід (WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(метоксііміно)-N-метил-2-[2-[(E)-{(1-[3-(трифторметил)феніл]етокси]іміно)метил]феніл]етанамід (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-фтор-2-фенілетеніл]окси]феніл]етиліден]аміно]окси]метил]феніл]-2-(метоксііміно)-N-

метилетанамід (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-[2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-дихлорфеніл)бут-3-ен-2-ілден]аміно]окси]метил]феніл]-2-(метоксиіміно)-N-метилетанамід, (3.28) 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)піридин-3-карбоксамід (119899-14-8), (3.29) 5-метокси-2-метил-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)феніл]етиліден] аміно]окси]метил]феніл)-2,4-дигідро-3H-1,2,4-тріазол-3-он, (3.30) метил (2E)-2-[2-[[[циклопропіл[(4-метоксифеніл)іміно]метил]сульфаніл]метил]феніл]-3-метоксипроп-2-еноат (149601-03-6), (3.31) N-(3-етил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-(форміламіно)-2-гідроксибензамід (226551-21-9), (3.32) 2-[2-[(2,5-диметилфенокси) метил]феніл]-2-метокси-N-метилацетамід (173662-97-0) і (3.33) (2R)-2-[2-[(2,5-диметилфенокси)метил]феніл]-2-метокси-N-метилацетамід (394657-24-0);

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

(15) інші сполуки, як, наприклад, (15.1) бентіазол (21564-17-0), (15.2) бетоксацин (163269-30-5), (15.3) капсимицин (70694-08-5), (15.4) карвон (99-49-0), (15.5) хінометіонат (2439-01-2), (15.6) піріофенон (хлазафенон) (688046-61-9), (15.7) цуфранеб (11096-18-7), (15.8) цифлуфенамід (180409-60-3), (15.9) цимоксаніл (57966-95-7), (15.10) ципросульфамід (221667-31-8), (15.11) дазомет (533-74-4), (15.12) дебакарб (62732-91-6), (15.13) дихлорфен (97-23-4), (15.14) дикломезин (62865-36-5), (15.15) дифензокват (49866-87-7), (15.16) дифензокват метилсульфат (43222-48-6), (15.17) дифеніламін (122-39-4), (15.18) екомат, (15.19) фенпіразамін (473798-59-3), (15.20) флуметовер (154025-04-4), (15.21) фторимід (41205-21-4), (15.22) флусульфамід (106917-52-6), (15.23) флутіаніл (304900-25-2), (15.24) фозетил-алюміній (39148-24-8), (15.25) фозетил-кальцій, (15.26) фозетил-натрій (39148-16-8), (15.27) гексахлорбензол (118-74-1), (15.28) ірумаміцин (81604-73-1), (15.29) метасульфокарб (66952-49-6), (15.30) метилізотіоціанат (556-61-6), (15.31) метрафенон (220899-03-6), (15.32) мілдіоміцин (67527-71-3), (15.33) натаміцин (7681-93-8), (15.34) диметилдитіокарбамат нікелю (15521-65-0), (15.35) нітротал-ізопропіл (10552-74-6), (15.36) октилінон (26530-20-1), (15.37) оксамокарб (917242-12-7), (15.38) оксифентіін (34407-87-9), (15.39) пентахлорфенол і солі (87-86-5), (15.40) фенотрин, (15.41) фосфориста кислота та її солі (13598-36-2), (15.42) пропамокарб-фозетилат, (15.43) пропанозин-натрій (88498-02-6), (15.44) прохіназид (189278-12-4), (15.45) піриморф (868390-90-3), (15.46) піролнітрин (1018-71-9) (EP-A 1 559 320), (15.47) тебуфлоквін (376645-78-2), (15.48) теклофталам (76280-91-6), (15.49) толніфанід (304911-98-6), (15.50) тріазоксид (72459-58-6), (15.51) трихламід (70193-21-4), (15.52) зариламід (84527-51-5), (15.53) (3S,6S,7R,8R)-8-бензил-3-[[[3-[(ізобутирилокси)метокси]-4-метоксипіридин-2-іл]карбоніл]аміно]-6-метил-4,9-діоксо-1,5-діоксонан-7-іл 2-метилпропаноат (517875-34-2) (WO2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003319-79-6) (WO 2008013622), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003319-80-9) (WO 2008013622), (15.56) 1-(4-{4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон (1003318-67-9) (WO 2008013622), (15.57) 1-(4-метоксифенокси)-3,3-диметилбутан-2-іл 1Н-імідазол-1-карбоксилат (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин (13108-52-6), (15.59) 2,3-дибутил-6-хлортієно[2,3-d]піримідин-4(3H)-он (221451-58-7), (15.60) 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитііно[2,3-с:5,6-с']дипірол-1,3,5,7(2Н,6Н)-тетрон, (15.61) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-[(5R)-5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)етанон (1003316-53-7) (WO 2008013622), (15.62) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-[(5S)-5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)етанон (1003316-54-8) (WO 2008013622), (15.63) 2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]-1-(4-{4-(5-феніл-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл)-1,3-тіазол-2-іл}піперидин-1-іл)етанон (1003316-51-5) (WO 2008013622), (15.64) 2-бутоксид-6-йод-3-пропіл-4Н-хромен-4-он, (15.65) 2-хлор-5-[2-хлор-1-(2,6-дифтор-4-метоксифеніл)-4-метил-1Н-імідазол-5-іл]піридин, (15.66) 2-фенілфенол та солі (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-трифтор-3,3-диметил-3,4-дигідроізохінолін-1-іл)хінолін (861647-85-0) (WO2005070917), (15.68) 3,4,5-тріхлорпіридин-2,6-дикарбонітрил (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметил-1,2-оксазолідин-3-іл]піридин, (15.70) 3-хлор-5-(4-хлорфеніл)-4-(2,6-дифторфеніл)-6-метилпіридазин, (15.71) 4-(4-хлорфеніл)-5-(2,6-дифторфеніл)-3,6-диметилпіридазин, (15.72) 5-аміно-1,3,4-тіадіазол-2-тіол, (15.73) 5-хлор-N'-феніл-N'-(проп-2-ін-1-іл)тіофен-2-сульфонгідрозид (134-31-6), (15.74) 5-фтор-2-[(4-фторбензил)окси]піримідин-4-амін (1174376-11-4) (WO2009094442), (15.75) 5-фтор-2-[(4-метилбензил)окси]піримідин-4-амін (1174376-25-0) (WO2009094442), (15.76) 5-метил-6-октил[1,2,4]тріазол[1,5-а]піримідин-7-амін, (15.77) етил (2Z)-3-аміно-2-ціано-3-фенілпроп-2-еноат, (15.78) N'-(4-{[3-(4-хлорбензил)-1,2,4-тіадіазол-5-іл]окси}-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилімідаформамід, (15.79) N-(4-хлорбензил)-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, (15.80) N-[(4-хлорфеніл)(ціано)метил]-3-[3-метокси-4-(проп-2-ін-1-ілокси)феніл]пропанамід, (15.81) N-[(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)метил]-2,4-дихлорпіридин-3-карбоксамід, (15.82) N-[1-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2-фтор-4-йодпіридин-3-карбоксамід, (15.83) N-[1-(5-бром-3-хлорпіридин-2-іл)етил]-2-фтор-4-йодпіридин-3-карбоксамід, (15.84) N-[(E)-[(циклопропілметокси)іміно]]6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл метил-2-фенілацетамід

(221201-92-9), (15.85) N-{(Z)-[(циклопропілметокси)іміно][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфеніл]метил}-2-феніл-ацетамід (221201-92-9), (15.86) N'-[4-[(3-терт-бутил-4-ціано-1,2-тіазол-5-іл)окси]-2-хлор-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідформамід, (15.87) N-метил-2-(1-[[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]ацетил]піперидин-4-іл)-N-(1,2,3,4-тетрагідро-нафтален-1-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-49-6) (WO 2007014290), (15.88) N-метил-2-(1-[[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]ацетил]піперидин-4-іл)-N-[(1R)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-07-6) (WO 2007014290), (15.89) N-метил-2-(1-[[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]ацетил]піперидин-4-іл)-N-[(1S)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]-1,3-тіазол-4-карбоксамід (922514-48-5) (WO 2007014290), (15.90) пентил {6-[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-іл)(феніл)метиліден] аміно]окси]метил]піридин-2-іл}карбамат, (15.91) феназин-1-карбонова кислота, (15.92) хінолін-8-ол (134-31-6), (15.93) хінолін-8-ол сульфат (2:1) (134-31-6) і (15.94) терт-бутил {6-[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-іл)(феніл)метиліден]аміно]окси]метил] піридин-2-іл}карбамат;

(16) інші сполуки, як, наприклад, (16.1) 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1Н-піразол-4-карбоксамід, (16.2) N-(4'-хлорбіфеніл-2-іл)-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід, (16.3) N-(2',4'-дихлорбіфеніл-2-іл)-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід, (16.4) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[4'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1Н-піразол-4-карбоксамід, (16.5) N-(2',5'-дифторбіфеніл-2-іл)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-4-карбоксамід, (16.6) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.7) 5-фтор-1,3-диметил-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.8) 2-хлор-N-[4'-(проп-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.9) 3-(дифторметил)-N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.10) N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-5-фтор-1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.11) 3-(дифторметил)-N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.12) N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)-5-фтор-1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.13) 2-хлор-N-(4'-етинілбіфеніл-2-іл)піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.14) 2-хлор-N-[4'-(3,3-диметилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.15) 4-(дифторметил)-2-метил-N-[4'-(трифторметил)біфеніл-2-іл]-1,3-тіазол-5-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.16) 5-фтор-N-[4'-(3-гідрокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.17) 2-хлор-N-[4'-(3-гідрокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.18) 3-(дифторметил)-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1-метил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.19) 5-фтор-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]-1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.20) 2-хлор-N-[4'-(3-метокси-3-метилбут-1-ін-1-іл)біфеніл-2-іл]піридин-3-карбоксамід (відомий з WO 2004/058723), (16.21) (5-бром-2-метокси-4-метилпіридин-3-іл)(2,3,4-триметокси-6-метилфеніл)метанон (відомий з EP-A 1 559 320) і (16.22) N-[2-(4-{[3-(4-хлорфеніл)проп-2-ін-1-іл]окси}-3-метоксифеніл)етил]-N2-(метилсульфоніл)валінамід (220706-93-4).

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

Композиція за винаходом, яка містить суміш сполуки формули (I) з бактерицидною сполукою, також може бути особливо корисною. Приклади підходящих для змішування бактерицидних партнерів можуть бути вибрані з такого переліку: бронопол, дихлорфен, нітрапирин, диметилдитіокарбамат нікелю, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофалам, сульфат міді та інші препарати міді.

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

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

Спосіб обробки за винаходом також може бути придатним для обробки матеріалу для розмноження, такого як клубні та кореневища, але також насіння, сіянців або висаджуваної розсади та рослин або висаджуваних рослин. Цей спосіб обробки також може бути придатним для обробки коренів. Спосіб обробки за винаходом також може бути придатним для обробки надземних частин

рослини, таких як стовбур, стебло або черешки, листя, квіти та плоди відповідної рослини.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Рослинами, які можна обробляти відповідно до винаходу, є гібридні рослини, які вже проявляють характеристики гетерозу або гібридної сили, результатом яких звичайно є більш висока врожайність, міцність, здоров'я та стійкість до факторів біотичного та абіотичного стресу. Такі рослини звичайно одержують шляхом схрещування інбредної батьківської лінії з чоловічим безпліддям (батьки жіночої статі) з іншою інбредною лінією з чоловічою плідністю (батьки чоловічої статі). Гібридне насіння звичайно збирають з чоловічих стерильних рослин і продають садоводам-городникам. Іноді чоловічі стерильні рослини можна одержати (наприклад, у кукурудзи) шляхом видалення мітелок або китиць, тобто механічним видаленням чоловічих репродуктивних органів (або чоловічих квіток), але, що є більш типовим, чоловіча стерильність є результатом генетичних детермінантів у геномі рослини. У такому разі, і особливо тоді, коли насіння є бажаним продуктом, врожай якого треба зібрати з гібридних рослин, звичайно є корисним забезпечити, щоб чоловіча плідність гібридних рослин була повністю відновлена. Це може бути здійснене шляхом забезпечення, щоб батьки чоловічої статі мали відповідні гени відновлення плідності, які здатні відновлювати чоловічу плідність в гібридних рослинах, які містять генетичні детермінанти, що відповідають за чоловіче безпліддя. Генетичні детермінанти

чоловічої стерильності можуть бути розташовані у цитоплазмі. Приклади цитоплазмової чоловічої стерильності (CMS), наприклад, були описані у сортів Brassica (WO 92/05251, WO 95/09910, WO 98/27806, WO 05/002324, WO 06/021972 і US 6,229,072). Проте, генетичні детермінанти для чоловічої стерильності також можуть бути розташовані в ядерному геномі. Рослини з чоловічою стерильністю також можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія. Особливо корисний засіб одержання рослин з чоловічою стерильністю описаний у WO 1989/10396, в якому, наприклад, рибонуклеазу, таку як барназа, селективно експресують у клітинах тапетуму в тичинках. Після цього плідність може бути відновлена експресією у клітинах тапетуму інгібітора рибонуклеази, такого як барстар (наприклад, у WO 1991/002069).

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

Стійкими до гербіцидів рослинами є, наприклад, гліфосат-толерантні рослини, тобто рослини, яким надана толерантність до гербіцидного гліфосату або його солей. Рослини можна зробити толерантними до гліфосату різними методами. Наприклад, гліфосат-толерантні рослини можна одержати трансформуванням рослини за допомогою гену, що кодує ензим 5-енолпірувілкімат-3-фосфатсинтази (EPSPS). Прикладами таких генів EPSPS є ген AroA (мутант CT7) бактерії *Salmonella typhimurium* (Comai та ін., 1983, Science 221, 370-371), ген CP4 бактерії виду *Agrobacterium* (Barry та ін., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145), гени, що кодують EPSPS петунії (Shah та ін., 1986, Science 233, 478-481), EPSPS томатів (Gasser та ін., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289), або EPSPS коракану (WO 01/66704). Це також може бути мутований EPSPS, як це описано, наприклад, у EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747 або WO 2002/026995. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати експресією гену, що кодує гліфосатний оксидо-редуктазний ензим, як це описано у US 5,776,760 та US 5,463,175. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати експресією гену, що кодує гліфосатний ацетилтрансферазний ензим, як це описано, наприклад, у WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 та WO 2007/024782. Гліфосат-толерантні рослини також можна одержати селекцією рослин, що містять природні мутації вищезгаданих генів, як описано, наприклад, у WO 2001/024615 або WO 2003/013226. Рослини, що експресують гени EPSPS, що надають толерантність до гліфосату, описані, наприклад, у патентних заявках США №№ 11/517,991, 10/739,610, 12/139,408, 12/352,532, 11/312,866, 11/315,678, 12/421,292, 11/400,598, 11/651,752, 11/681,285, 11/605,824, 12/468,205, 11/760,570, 11/762,526, 11/769,327, 11/769,255, 11/943801 або 12/362,774. Рослини, що містять інші гени, що надають толерантність до гліфосату, такі як гени декарбоксилази, описані, наприклад, у патентних заявках США №№ 11/588,811, 11/185,342, 12/364,724, 11/185,560 або 12/423,926.

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

Іншими гербіцид-толерантними рослинами є також рослини, яким надана толерантність до гербіцидів, що інгібують ензимну гідроксифенілпіруват-діоксигеназу (HPPD). Гідроксифенілпіруватдіоксигенази є ензимами, що каталізують реакцію, в якій пара-гідроксифенілпіруват (HPP) трансформується у гомогентисат. Рослини, толерантні до HPPD-інгібіторів, можуть бути трансформовані за допомогою гену, що кодує природний стійкий HPPD ензим, або гену, що кодує мутований або химерний HPPD ензим, як це описано у міжнародних заявках WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 або патенті США US 6,768,044. Толерантність до HPPD-інгібіторів також може бути досягнута шляхом трансформування рослин за допомогою генів, які кодують певні ензими, що дозволяє утворення гомогентисату, незважаючи на інгібування нативного HPPD ензиму HPPD-інгібітором. Такі рослини та гени описані в міжнародних заявках WO 99/34008 і WO 02/36787. Толерантність рослин до HPPD інгібіторів може бути також покращена трансформуванням рослин за допомогою гену, що кодує ензим, який має активність префенатдегідрогенази (PDH), на додаток

до гену, що кодує HPPD-толерантний ензим, як це описано у міжнародній заявці WO 2004/024928. Крім того, рослинам може бути надана більша толерантність до HPPD-інгібіторних гербіцидів шляхом додавання до їхнього геному гену, що кодує ензим, здатний до засвоєння або руйнування HPPD-інгібіторів, такий як ензими CYP450, показані в міжнародних заявках WO 2007/103567 і WO 2008/150473.

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

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

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

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

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

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

2) кристалічний білок *Bacillus thuringiensis* або його частку, що є інсектицидною у присутності другого іншого кристалічного білка виду *Bacillus thuringiensis* або його частки, такого як бінарний токсин, складений з кристалічних білків Cry34 і Cry35 (Moellenbeck та ін. 2001, *Nat. Biotechnol.* 19: 668-72; Schnepf та ін. 2006, *Applied Environm. Microbiol.* 71, 1765-1774) або бінарний токсин, складений з білків Cry1A або Cry1F і білків Cry2Aa або Cry2Ab або Cry2Ae (патентні заявки США № 12/214,022 і EP № 08010791.5); або

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

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

5) інсектицидний секретований білок з *Bacillus thuringiensis* або *Bacillus cereus* або його інсектицидна частка, такий як вегетативні інсектицидні білки (VIP), перелік яких наведено на сайті:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, наприклад, білки з класу білків VIP3Aa; або

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

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

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

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

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

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

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

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

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

2) рослини, які містять трансген, що підсилює толерантність до стресу, здатний знижувати експресію та/або активність PARC кодувальних генів рослин або клітин рослин, як це описано, наприклад, у WO 2004/090140;

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

е) рослини, такі як рослини бавовни, в яких змінена синхронізація плазмодесматального стробування в основі клітини волокна, наприклад шляхом даун-регуляції волоконселективної β -1,3-глюканази, як ті, що описані у WO 2005/017157, або як ті, що описані у EP 08075514.3 або патентній заявці США №61/128,938;

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

Рослинами або культиварами рослин (що можуть бути одержані методами рослинної біотехнології, такими як генна інженерія), які також можна обробляти відповідно до винаходу, є

рослини, такі як олійний рапс або споріднені рослини сорту Brassica, зі зміненими характеристиками олійного профілю. Такі рослини можна одержати генною трансформацією або селекцією рослин, які містять мутацію, що надає таких змінених характеристик олійного профілю, до яких відносяться:

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

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

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

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

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

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

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

- Організація: найменування юридичної особи, що подає клопотання.

- Об'єкт регулювання: відповідний сорт рослин.

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

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

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

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

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

Таблиця А

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

Таблиця В

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

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

Скорочення:

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

Клопотання про надання нерегульованого статусу, що перебувають на розгляді					
Документи заявника					
Клопо- тання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулю- вання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
10-070-01p		Virginia Tech	Арахіс	Стійкий до склеротиніозу	N70, P39 та W171
09-349-01p		Dow AgroSciences	Соя	Толерантний до гербіцидів	DAS-68416-4
09-328-01p		Bayer Crop Science	Соя	Толерантний до гербіцидів	FG72
09-233-01p		Dow	Куку-рудза	Толерантний до гербіцидів	DAS-40278-9
09-201-01p		Monsanto	Соя		MON-87705-6
09-183-01p		Monsanto	Соя		MON-87769
09-082-01p		Monsanto	Соя	Стійкий до лускокрилих	MON 87701
09-063-01p		Stine Seed	Куку-рудза	Толерантний до гліфосату	HCEM485
09-055-01p		Monsanto	Куку-рудза	Стійкий до посухи	MON 87460
09-015-01p		BASF Plant Science, LLC	Соя	Толерантний до гербіцидів	BPS-CV127-9 Соя
08-366-01p		ArborGen	Евкалипт	Морозостійкий, зі зміненою плодовитістю	ARB-FTE1-08
08-340-01p		Bayer	Бавовна	Толерантний до глюфозинату, стійкий до комах	T304-40XGHB119
08-338-01p		Pioneer	Куку-рудза	З чоловічою стерильністю, з відновленою плодовитістю, візуальний маркер	DP-32138-1
08-315-01p		Florigene	Троянда	Зі зміненим кольором квітів	IFD-52401-4 і IFD-52901-9
07-253-01p		Syngenta	Куку-рудза	Стійкий до лускокрилих	MIR-162 Maїс
07-108-01p		Syngenta	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	COT67B
06-354-01p		Pioneer	Соя	З високим вмістом олеїнової кислоти	DP-305423-1
05-280-01p		Syngenta	Куку-рудза	Теплостійка альфа-амілаза	3272
04-110-01p		Monsanto та Forage Genetics	Люцерна	Толерантний до гліфосату	J101, J163

03-104-01p		Monsanto та Scotts	Польовиця біла	Толерантний до гліфосату	ASR368
Задоволені клопотання про надання нерегульованого статусу					
Документи заявника					
Клопотання	Поширення клопотання № ***	Організація	Об'єкт регулювання	Трансгенний фенотип	Трансформаційна подія або лінія
07-152-01p		Pioneer	Кукурудза	Толерантний до гліфосату та імідазолінону	DP-098140-6
04-337-01p		University of Florida	Папайя	Стійкий до вірусу кільцевої плямистості папайї	X17-2
06-332-01p		Bayer CropScience	Бавовна	Толерантний до гліфосату	GHB614
06-298-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійка до метелика кукурудзяного	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	Соя	Толерантний до гліфосату та ацетолактатсинтази	356043 (DP-356Ø43-5)
06-234-01p	98-329-01p	Bayer CropScience	Рис	Толерантний до фосфінотрицину	LLPIC601
06-178-01p		Monsanto	Соя	Толерантний до гліфосату	MON 89788
04-362-01p		Syngenta	Кукурудза	Захищений від злакового кореневого черв'яка	MIR604
04-264-01p		ARS	Сливи	Стійкий до вірусу «віспи» сливи (прихованої мозаїки сливи)	C5
04-229-01p		Monsanto	Кукурудза	Високолізиновий	LY038
04-125-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	88017
04-086-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	MON 88913
03-353-01p		Dow	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	59122
03-323-01p		Monsanto	Цукровий буряк	Толерантний до гліфосату	H7-1
03-181-01p	00-136-01p	Dow	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих і толерантний до фосфінотрицину	TC-6275
03-155-01p		Syngenta	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	COT 102
03-036-01p		Mycogen/Dow	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	281-24-236

03-036-02p		Mycogen/Dow	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	3006-210-23
02-042-01p		Aventis	Бавовна	Толерантний до фосфінотрицину	LLБавовна25
01-324-01p	98-216-01p	Monsanto	Насіння рапсу	Толерантний до гліфосату	RT200
01-206-01p	98-278-01p	Aventis	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину та з контролем запилення	MS1 та RF1/RF2
01-206-02p	97-205-01p	Aventis	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину	Topas 19/2
01-137-01p		Monsanto	Кукурудза	Стійкий до злакового кореневого черв'яка	MON 863
01-121-01p		Vector	Тютюн	Зі зниженим вмістом нікотину	Вектор 21-41
00-342-01p		Monsanto	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	Подія в бавовні 15985
00-136-01p		Mycogen c/o Dow та Pioneer	Кукурудза	Стійкий до лускокрилих та фосфінотрицину	Лінія 1507
00-011-01p	97-099-01p	Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату	NK603
99-173-01p	97-204-01p	Monsanto	Картопля	Стійкий до PLRV та CPB	RBMT22-82
98-349-01p	95-228-01p	AgrEvo	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину та з чоловічою стерильністю	MS6
98-335-01p		Університет Саскачевану	Льон	Толерантний до залишків гербіциду сульфоніл сечовини в ґрунті	CDC Triffid
98-329-01p		AgrEvo	Рис	Толерантний до фосфінотрицину	LLPIC06, LLPIC62
98-278-01p		AgrEvo	Насіння рапсу	Толерантний до фосфінотрицину і з контролем запилення	MS8 та RF3
98-238-01p		AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	GU262
98-216-01p		Monsanto	Насіння рапсу	Толерантний до гліфосату	RT73
98-173-01p		Novartis Seeds та Monsanto	Буряк	Толерантний до гліфосату	GTSB77
98-014-01p	96-068-01p	AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	A5547-127
97-342-01p		Pioneer	Кукурудза	З чоловічою стерильністю і толерантний до фосфінотрицину	676, 678, 680
97-339-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB та PVY	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-

					15
97-336-01p		AgrEvo	Буряк	Толерантний до фосфінотрицину	T-120-7
97-287-01p		Monsanto	Томати	Стійкий до лускокрилих	5345
97-265-01p		AgrEvo	Кукурудза	Толерантний до фосфінотрицину та Lep.	CBH-351
97-205-01p		AgrEvo	Насіння рапсу	Фосфінотрицин tolerant	T45
97-204-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB та PLRV	RBMT21-129 та RBMT21-350
97-148-01p		Bejo	Цикорій звичайний	З чоловічою стерильністю	RM3-3, RM3-4, RM3-6
97-099-01p		Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату	GA21
97-013-01p		Calgene	Бавовна	Толерантний до бромксинілу та стійкий до лускокрилих	Події 31807 та 31808
97-008-01p		Du Pont	Соя	Зі зміненим олійним профілем	G94-1, G94-19, G-168
96-317-01p		Monsanto	Кукурудза	Толерантний до гліфосату та стійкий до ECB	MON802
96-291-01p		DeKalb	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	1 додаткова лінія FLAVRSAVR
96-068-01p		AgrEvo	Соя	Толерантний до фосфінотрицину	W62, W98, A2704- 12, A2704-21, A5547-35
96-051-01p		Cornell U	Папайя	Стійкий до PRSV	55-1, 63-1
96-017-01p	95-093-01p	Monsanto	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	MON809 та MON810
95-352-01p		Asgrow	Гарбуз	Стійкий до CMV, ZYMV, WMV2	CZW-3
95-338-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до CPB	SBT02-5 та -7, ATBT04-6 та -27, -30, -31, -36
95-324-01p		Agritope	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	Бавовна	Толерантний до сульфонісечовини	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	Кукурудза	З чоловічою стерильністю	MS3
95-195-01p		Northrup King	Кукурудза	Стійкий до кукурудзяного метелика	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	2 додаткові лінії FLAVRSAVR

95-145-01p		DeKalb	Куку-рудза	Фосфінотрицин tolerant	B16
95-093-01p		Monsanto	Куку-рудза	Стійкий до лускокрилих	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	8338
95-045-01p		Monsanto	Бавовна	Толерантний до гліфосату	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	20 додаткових ліній FLAVRSAVR
94-357-01p		AgrEvo	Куку-рудза	Фосфінотрицин tolerant	T14, T25
94-319-01p		Ciba Seeds	Куку-рудза	Стійкий до лускокрилих	Подія 176
94-308-01p		Monsanto	Бавовна	Стійкий до лускокрилих	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca та Petoseed	Томати	Зі зниженим рівнем полігалактуранази в плодах	B, Da, F
94-257-01p		Monsanto	Картопля	Стійкий до жорсткокрилих	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23
94-230-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	9 додаткових ліній FLAVRSAVR
94-228-01p		DNA Plant Tech	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	Calgene	Томати	Зі зміненим дозріванням плодів	Line N73 1436-111
94-090-01p		Calgene	Насіння рапсу	Зі зміненим олійним профілем	pCGN3828-212/86- 18 та 23
93-258-01p		Monsanto	Соя	Толерантний до гліфосату	40-3-2
93-196-01p		Calgene	Бавовна	Толерантний до бромксинілу	BXN
92-204-01p		Upjohn	Гарбуз	Стійкий до WMV2 та ZYMV	ZW-20
92-196-01p		Calgene	Томати	Змінене дозрівання плодів	FLAVR SAVR

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

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

Таблиця С

Вид рослини	Подія	Ознака	Патентний документ
Кукурудза	PV-ZMGT32 (NK603)	Толерантність до гліфосату	US 2007-056056
Кукурудза	MIR604	Стійкість до комах (Cry3a055)	EP 1 737 290
Кукурудза	LY038	Високий вміст лізину	US 7,157,281
Кукурудза	3272	Самообробна кукурудза (альфа-амілаза)	US 2006-230473
Кукурудза	PV-ZMIR13 (MON863)	Стійкість до комах (Cry3Bb)	US 2006-095986
Кукурудза	DAS-59122-7	Стійкість до комах (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139
Кукурудза	TC1507	Стійкість до комах (Cry1F)	US 7,435,807
Кукурудза	MON810	Стійкість до комах (Cry1Ab)	US 2004-180373
Кукурудза	VIP1034	Стійкість до комах	WO 03/052073
Кукурудза	B16	Стійкість до глюфозинату	US 2003-126634
Кукурудза	GA21	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GG25	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GJ11	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	FI117	Стійкість до гліфосату	US 6,040,497
Кукурудза	GAT-ZM1	Толерантність до гліфосату	WO 01/51654
Кукурудза	MON87460	Посухостійкість	WO 2009/111263
Кукурудза	DP-098140-6	Толерантність до гліфосату / інгібіторів ALS	WO 2008/112019
Пшениця	Подія1	Стійкість до збудника фузаріозу (трихотецен 3-О-ацетилтрансферази)	CA 2561992
Цукровий буряк	T227-1	Толерантність до гліфосату	US 2004-117870
Цукровий буряк	H7-1	Толерантність до гліфосату	WO 2004-074492
Соя	MON89788	Толерантність до гліфосату	US 2006-282915
Соя	A2704-12	Толерантність до гліфосату	WO 2006/108674
Соя	A5547-35	Толерантність до гліфосату	WO 2006/108675
Соя	DP-305423-1	Високий вміст олеїнової кислоти / стійкість до інгібіторів ALS	WO 2008/054747
Рис	GAT-OS2	Толерантність до гліфосату	WO 01/83818
Рис	GAT-OS3	Толерантність до гліфосату	US 2008-289060
Рис	PE-7	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2008/114282
Олійний рапс	MS-B2	Чоловіча стерильність	WO 01/31042
Олійний рапс	MS-BN1/RF-BN1	Чоловіча стерильність/відновлення	WO 01/41558
Олійний рапс	RT73	Стійкість до гліфосату	WO 02/36831
Бавовна	CE43-67B	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128573
Бавовна	CE46-02A	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128572
Бавовна	CE44-69D	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128571
Бавовна	1143-14A	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128569
Бавовна	1143-51B	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128570
Бавовна	T342-142	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2006/128568
Бавовна	Подія 3006-210-23	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2005/103266
Бавовна	PV-GHGT07 (1445)	Толерантність до гліфосату	US 2004-148666
Бавовна	MON88913	Толерантність до гліфосату	WO 2004/072235
Бавовна	EE-GH3	Толерантність до гліфосату	WO 2007/017186
Бавовна	T304-40	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO2008/122406
Бавовна	Cot202	Стійкість до комах (VIP3)	US 2007-067868
Бавовна	LLбавовна25	Стійкість до глюфозинату	WO 2007/017186

Бавовна	ЕЕ-GH5	Стійкість до комах (Cry1Ab)	WO 2008/122406
Бавовна	Подія 281-24-236	Стійкість до комах (Cry1F)	WO 2005/103266
Бавовна	Cot102	Стійкість до комах (Vip3A)	US 2006-130175
Бавовна	MON 15985	Стійкість до комах (Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317
Польовиця	Asr-368	Толерантність до гліфосату	US 2006-162007
Баклажан	ЕЕ-1	Стійкість до комах (Cry1Ac)	WO 2007/091277

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

- Хвороби борошнистої роси, такі як:
- Хвороби блюмерії (*Blumeria*), спричинені, наприклад, *Blumeria graminis*;
- Хвороби подосфери (*Podosphaera*), спричинені, наприклад, *Podosphaera leucotricha*;
- Хвороби сфаротеки (*Sphaerotheca*), спричинені, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*;
- Хвороби унцинули (*Uncinula*), спричинені, наприклад, *Uncinula necator*;
- Хвороби іржавіння, такі як:
- Хвороби гімноспорангію (*Gymnosporangium*), спричинені, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*;
- Хвороби гемілеї (*Hemileia*), спричинені, наприклад, *Hemileia vastatrix*;
- Хвороби факопсори (*Phakopsora*), спричинені, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomia*;
- Хвороби пущинії (*Puccinia*), спричинені, наприклад, *Puccinia recondite*, *Puccinia graminis* або *Puccinia striiformis*;
- Хвороби уроміцесу (*Uromyces*), спричинені, наприклад, *Uromyces appendiculatus*;
- Хвороби ооміцету (*Oomycete*), такі як:
- Хвороби альбуги (*Albugo*), спричинені, наприклад, *Albugo candida*;
- Хвороби бремії (*Bremia*), спричинені, наприклад, *Bremia lactucae*;
- Хвороби пероноспори (*Peronospora*), спричинені, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;
- Хвороби фітофтори (*Phytophthora*), спричинені, наприклад, *Phytophthora infestans*;
- Хвороби плазмопари (*Plasmopara*), спричинені, наприклад, *Plasmopara viticola*;
- Хвороби псевдопероноспори (*Pseudoperonospora*), спричинені, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;
- Хвороби пітію (*Pythium*), спричинені, наприклад, *Pythium ultimum*;
- Хвороби плямистості листя: плями, прищі, тля, такі як:
- Хвороби альтернатрії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, *Alternaria solani*;
- Хвороби церкоспори (*Cercospora*), спричинені, наприклад, *Cercospora beticola*;
- Хвороби кладіоспору (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, *Cladosporium cucumerinum*;
- Хвороби кохліоболусу (*Cochliobolus*), спричинені, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідій: *Drechslera*), синонім: *Helminthosporium* або *Cochliobolus miyabeanus*;
- Хвороби колетотрихуму (*Colletotrichum*), спричинені, наприклад, *Colletotrichum lindemuthianum*;
- Хвороби циклоконію (*Cycloconium*), спричинені, наприклад, *Cycloconium oleaginum*;
- Хвороби діапорте (*Diaporthe*), спричинені, наприклад, *Diaporthe citri*;
- Хвороби ельсине (*Elsinoe*), спричинені, наприклад, *Elsinoe fawcettii*;
- Хвороби глеоспорію (*Gloeosporium*), спричинені, наприклад, *Gloeosporium laeticolor*;
- Хвороби гломерели (*Glomerella*), спричинені, наприклад, *Glomerella cingulata*;
- Хвороби гігнاردії (*Guignardia*), спричинені, наприклад, *Guignardia bidwelli*;
- Хвороби лептосферії (*Leptosphaeria*), спричинені, наприклад, *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;
- Хвороби магнапорте (*Magnaporthe*), спричинені, наприклад, *Magnaporthe grisea*;
- Хвороби мікосфарели (*Mycosphaerella*), спричинені, наприклад, *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- Хвороби фасфарії (*Phaeosphaeria*), спричинені, наприклад, *Phaeosphaeria nodorum*;
- Хвороби піренофори (*Pyrenophora*), спричинені, наприклад, *Pyrenophora teres* або *Pyrenophora tritici repentis*;
- Хвороби рамуларії (*Ramularia*), спричинені, наприклад, *Ramularia collo-cygni* або *Ramularia areola*;
- Хвороби ринхоспорію (*Rhynchosporium*), спричинені, наприклад, *Rhynchosporium secalis*;
- Хвороби септорії (*Septoria*), спричинені, наприклад, *Septoria apii* або *Septoria lycopersici*;
- Хвороби тифули (*Typhula*), спричинені, наприклад, *Typhula incarnata*;
- Хвороби вентурії (*Venturia*), спричинені, наприклад, *Venturia inaequalis*; Хвороби коріння та

стебла, такі як:

Хвороби кортицію (*Corticium*), спричинені, наприклад, *Corticium graminarum*;
Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium oxysporum*;
Хвороби геуманоміцію (*Gaeumannomyces*), спричинені, наприклад, *Gaeumannomyces graminis*;
Хвороби ризоктонії (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;
Хвороби сарокладію (*Sarocladium*), спричинені, наприклад, *Sarocladium oryzae*;
Хвороби склеротію (*Sclerotium*), спричинені, наприклад, *Sclerotium oryzae*;
Хвороби тапесії (*Tapesia*), спричинені, наприклад, *Tapesia acuformis*;
Хвороби тилавіопсису (*Thielaviopsis*), спричинені, наприклад, *Thielaviopsis basicola*;
Хвороби колосся та суцвіття у вигляді мітли, такі як:
Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, видом *Alternaria*;
Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
Хвороби кладоспорію (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, видом *Cladosporium*;
Хвороби клавіцепсу (*Claviceps*), спричинені, наприклад, *Claviceps purpurea*;
Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;
Хвороби гіберели (*Gibberella*), спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;
Хвороби монографели (*Monographella*), спричинені, наприклад, *Monographella nivalis*;
Хвороби головні та мокрої головні, такі як:
Хвороби сфацелотеки (*Sphacelotheca*), спричинені, наприклад, *Sphacelotheca reiliana*;
Хвороби тилетії (*Tilletia*), спричинені, наприклад, *Tilletia caries*;
Хвороби уроцистису (*Urocystis*), спричинені, наприклад, *Urocystis occulta*;
Хвороби устилаго (*Ustilago*), спричинені, наприклад, *Ustilago nuda*;
Хвороби гниття та плісняви фруктів, такі як:
Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
Хвороби ботритису (*Botrytis*), спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*;
Хвороби пеніцилію (*Penicillium*), спричинені, наприклад, *Penicillium expansum*;
Хвороби ризофусу (*Rhizopus*), спричинені, наприклад, *Rhizopus stolonifer*;
Хвороби склеротинії (*Sclerotinia*), спричинені, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*;
Хвороби вертицилію (*Verticillium*), спричинені, наприклад, *Verticillium albo-atrum*;
Хвороби гниття, плісняви, зів'янення, гнилизни і випівання (чорної ніжки) насіння та ґрунту, такі

як:

Хвороби альтернарії (*Alternaria*), спричинені, наприклад, *Alternaria brassicicola*;
Хвороби афаноміцесу (*Aphanomyces*), спричинені, наприклад, *Aphanomyces euteiches*;
Хвороби аскохіта (*Ascochyta*), спричинені, наприклад, *Ascochyta lentis*;
Хвороби аспергілусу (*Aspergillus*), спричинені, наприклад, *Aspergillus flavus*;
Хвороби кладоспорію (*Cladosporium*), спричинені, наприклад, *Cladosporium herbarum*;
Хвороби кохліоболусу (*Cochliobolus*), спричинені, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідій: *Drechslera*, *Bipolaris*, синонім: *Helminthosporium*);

Хвороби колетотрихуму (*Colletotrichum*), спричинені, наприклад, *Colletotrichum coccodes*;
Хвороби фузарію (*Fusarium*), спричинені, наприклад, *Fusarium culmorum*;
Хвороби гіберели (*Gibberella*), спричинені, наприклад, *Gibberella zeae*;
Хвороби макрофоміни (*Macrophomina*), спричинені, наприклад, *Macrophomina phaseolina*;
Хвороби монографели (*Monographella*), спричинені, наприклад, *Monographella nivalis*;
Хвороби пеніцилію (*Penicillium*), спричинені, наприклад, *Penicillium expansum*;
Хвороби фома (*Phoma*), спричинені, наприклад, *Phoma lingam*;
Хвороби фомопсису (*Phomopsis*), спричинені, наприклад, *Phomopsis sojae*;
Хвороби фітофтори (*Phytophthora*), спричинені, наприклад, *Phytophthora cactorum*;
Хвороби піренофори (*Pyrenophora*), спричинені, наприклад, *Pyrenophora graminis*;
Хвороби пірикулярію (*Pyricularia*), спричинені, наприклад, *Pyricularia oryzae*;
Хвороби пітію (*Pythium*), спричинені, наприклад, *Pythium ultimum*;
Хвороби ризоктонії (*Rhizoctonia*), спричинені, наприклад, *Rhizoctonia solani*;
Хвороби ризопусу (*Rhizopus*), спричинені, наприклад, *Rhizopus oryzae*;
Хвороби склеротію (*Sclerotium*), спричинені, наприклад, *Sclerotium rolfsii*;
Хвороби септорії (*Septoria*), спричинені, наприклад, *Septoria nodorum*;
Хвороби тифули (*Typhula*), спричинені, наприклад, *Typhula incarnata*;
Хвороби вертицилію (*Verticillium*), спричинені, наприклад, *Verticillium dahliae*;
Хвороби у вигляді червоточини, засихання вершин та мітел, такі як:
Хвороби нектрії (*Nectria*), спричинені, наприклад, *Nectria galligena*;
Хвороби, які характеризуються зів'яненням, гниттям або припиненням росту, такі як:
Хвороби монілінії (*Monilinia*), спричинені, наприклад, *Monilinia laxa*;

Хвороби пухирчастості або закручування листя, такі як:

Хвороби екзобазидію (*Exobasidium*), спричинені, наприклад, *Exobasidium vexans*;

Хвороби тафрини (*Taphrina*), спричинені, наприклад, *Taphrina deformans*;

Хвороби погіршення стану дерев'янистих рослин, такі як:

Хвороби еска (*Esca*), спричинені, наприклад, *Phaemoniella clamydospora*;

Хвороби еutipа дайбек (*Eutypa dieback*), спричинені, наприклад, *Eutypa lata*;

Хвороби ганодерма (*Ganoderma*), спричинені, наприклад, *Ganoderma boninense*;

Хвороби ригідопорусу (*Rigidoporus*), спричинені, наприклад, *Rigidoporus lignosus*;

Хвороби квітів і насіння, такі як:

Хвороби ботритису (*Botrytis*), спричинені, наприклад, *Botrytis cinerea*;

Хвороби бульби, такі як:

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

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

Хвороби кіли хрестоцвітних, такі як:

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

Хвороби, спричинені бактерійними організмами, такими як:

Вид ксантоманас (*Xanthomonas*), наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Вид псевдомонас (*Pseudomonas*), наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

Вид ервінія (*Erwinia*), наприклад, *Erwinia amylovora*.

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

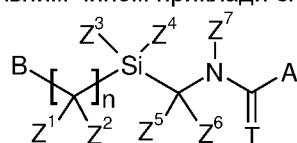
Доза активної сполуки, яку звичайно наносять способом обробки відповідно до винаходу, звичайно і переважно становить від 10 до 800 г/га, краще від 50 до 300 г/га для нанесення при обробці листя. Доза нанесеної активної речовини звичайно і переважно становить від 2 до 200 г на 100 кг насіння, краще від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

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

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

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

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



(I)

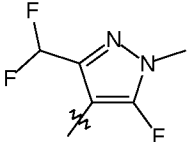
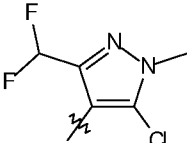
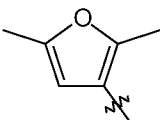
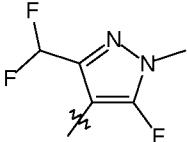
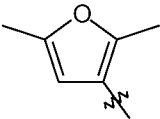
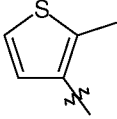
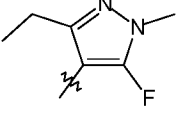
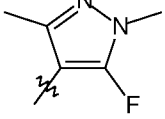
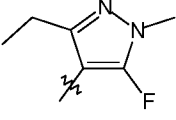
У таблиці 1, якщо не вказано інакше, M+H (Apcl⁺) означає пік молекулярних іонів плюс 1 ч.а.м. (частка атомної маси), як це спостерігали під час масової спектроскопії шляхом хімічної іонізації позитивного атмосферного тиску.

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

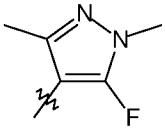
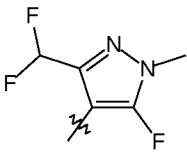
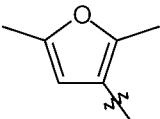
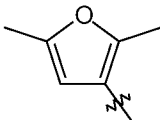
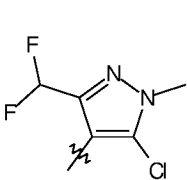
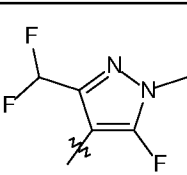
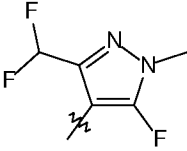
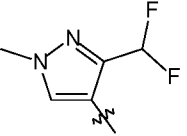
Температура: 40°C; Мобільні фази: 0,1% водна мурашина кислота та ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу.

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

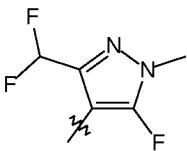
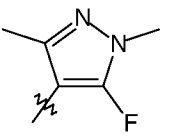
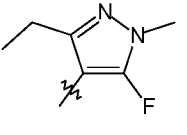
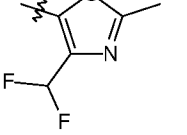
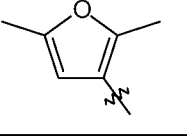
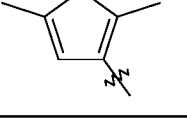
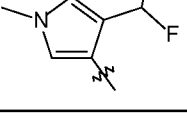
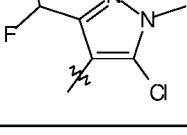
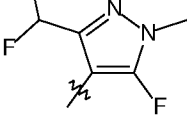
Таблиця 1

При- клад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
1		O	0			Me	Me	H	H	H	феніл	3,13	342
2		O	0			Me	Me	H	H	H	феніл	3,31	358
3		O	0			Me	Me	H	H	H	феніл	3,48	288
4		O	0			Me	Me	H	H	methyl	феніл	3,23	356
5		O	0			Me	Me	H	H	methyl	феніл	3,73	302
6		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл		442
7		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	3,64	360
8		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	3,19	345 ⁽¹⁾
9		S	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	4,41	376

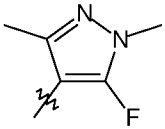
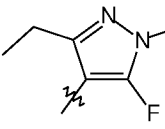
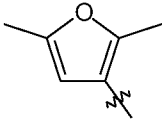
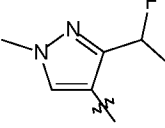
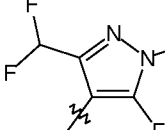
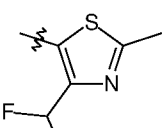
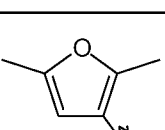
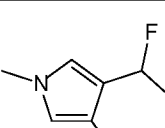
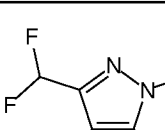
Таблиця 1

При- клад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
10		S	0			Me	Me	H	H	цикло- ропіл	феніл	3,99	362
11		O	0			Me	Me	H	H	цикло- гексил	феніл	4,86	424
12		O	0			Me	Me	H	H	цикло- гексил	феніл	5,62	370
13		O	0			Me	Me	H	H	H	2-хлор- феніл	3,85	322
14		O	0			Me	Me	H	H	H	2-хлор- феніл	3,69	392
15		O	0			Me	Me	H	H	H	2-хлор- феніл	3,48	376
16		S	0			Me	Me	H	H	H	2-хлор- феніл	4,11	392
17		O	0			Me	Me	H	H	цикло- ропіл	2-хлор- феніл	3,73	398

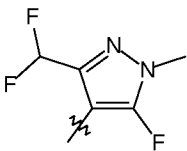
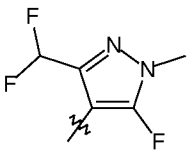
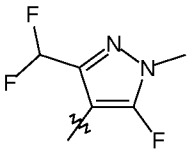
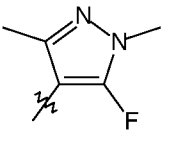
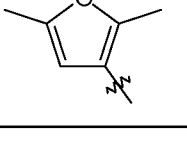
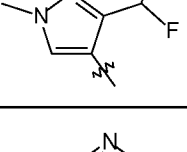
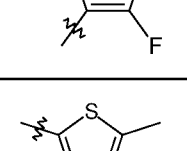
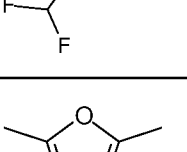
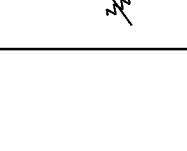
Таблиця 1

Приклад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
18		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	2-хлорфеніл	4,13	416
19		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	2-хлорфеніл	3,60	380
20		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	2-хлорфеніл	4,03	394
21		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	2-хлорфеніл	4,32	415
22		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	2-хлорфеніл	4,74	362
23		O	0			Me	Me	H	H	H	3-хлорфеніл	3,92	322
24		O	0			Me	Me	H	H	H	3-хлорфеніл	3,58	357
25		O	0			Me	Me	H	H	H	3-хлорфеніл	3,71	392
26		O	0			Me	Me	H	H	H	3-хлорфеніл	3,55	376

Таблиця 1

Приклад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
27		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	3,67	380
28		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	4,08	394
29		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	4,78	362
30		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	3,80	398
31		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	4,18	416
32		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	3-хлорфеніл	4,32	415
33		O	0			Me	Me	H	H	H	2,4-дихлорфеніл	4,46	356
34		O	0			Me	Me	H	H	H	2,4-дихлорфеніл	4,06	391
35		O	0			Me	Me	H	H	H	2,4-дихлорфеніл	4,25	426

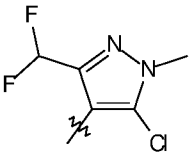
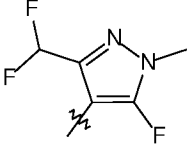
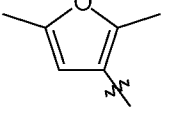
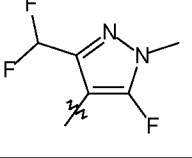
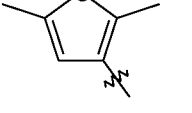
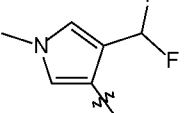
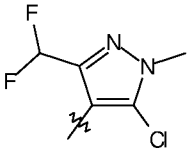
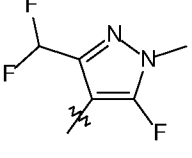
Таблиця 1

Приклад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
36		O	0			Me	Me	H	H	H	2,4-дихлор-феніл	4,06	410
37		S	0			Me	Me	H	H	H	2,4-дихлор-феніл	4,74	426
38		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	4,78	450
39		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	4,30	414
40		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	5,46	396
41		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	4,41	432
42		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	4,78	428
43		O	0			Me	Me	H	H	циклоп-ропіл	2,4-дихлор-феніл	5,00	449
44		O	0			Me	Me	H	H	H	3,5-дихлор-феніл	4,54	356

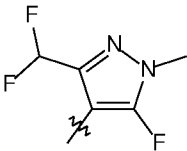
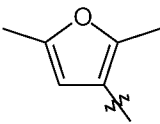
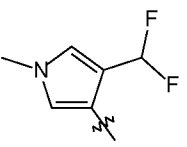
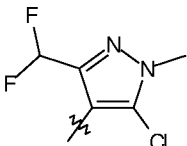
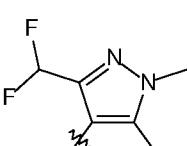
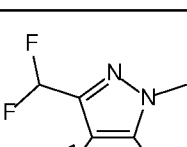
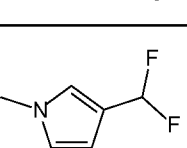
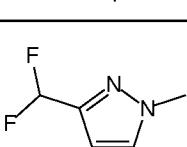
Таблиця 1

При- клад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
45		O	0			Me	Me	H	H	H	3,5- дихлор- феніл	4,11	391
46		O	0			Me	Me	H	H	H	3,5- дихлор- феніл	4,27	426
47		O	0			Me	Me	H	H	H	3,5- дихлор- феніл	4,08	410
48		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	4,34	414
49		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	4,78	428
50		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	5,51	396
51		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	4,41	432
52		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	4,78	450
53		O	0			Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	4,92	449

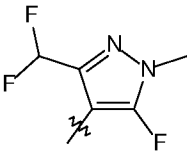
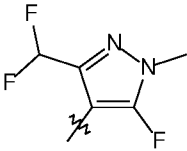
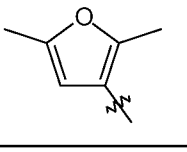
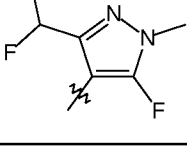
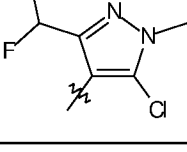
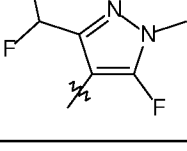
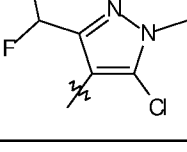
Таблиця 1

При- клад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
54		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	4,20	412
55		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	4,03	396
56		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	4,67	342
57		S	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	феніл	4,67	412
58		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2-хлор- феніл	5,08	376
59		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2-хлор- феніл	4,56	411
60		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2-хлор- феніл	4,56	446
61		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2-хлор- феніл	4,41	430

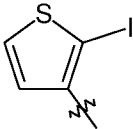
Таблиця 1

При- клад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
62		S	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2-хлор- феніл	5,00	446
63		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3-хлор- феніл	5,11	376
64		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3-хлор- феніл	4,62	411
65		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3-хлор- феніл	4,59	446
66		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3-хлор- феніл	4,44	430
67		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	3,5- дихлор- феніл	5,14	480
68		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2,4- дихлор- феніл	5,19	445
69		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклоп- ропіл	2,4- дихлор- феніл	5,19	480

Таблиця 1

Приклад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
70		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклопропіл	2,4-дихлорфеніл	5,03	464
71		S	1	H	H	Me	Me	H	H	циклопропіл	2,4-дихлорфеніл	5,57	480
72		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклопропіл	3,5-дихлорфеніл	4,98	464
73		O	1	H	H	Me	Me	H	H	циклопропіл	2,4-дихлорфеніл	5,78	410
74		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	нафта-лен-2-іл	4,36	432
75		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	тіофен-3-іл	3,71	404
76		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	тіофен-3-іл	3,55	388
77		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	нафта-лен-2-іл	4,51	448

Таблиця 1

Приклад	A	T	n	Z1	Z2	Z3	Z4	Z5	Z6	Z7	B	logP	Мас (M+H)
78		O	0			Me	Me	H	H	циклопропіл	нафта-лен-2-іл	5,17	492

Примітка (1): пік молекулярних іонів M (Apcl+)

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

Приклад одержання 1: одержання N-циклопропіл-N-{{диметил(феніл)силіл}метил}-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду (сполука 8)

Стадія 1: одержання N-{{диметил(феніл)силіл}метил}циклопропанаміну

До 5 г (27 ммоль) (хлорметил)(диметил)фенілсилану, розчиненого у 30 мл циклопропіламіну, додали 400 мг (2,7 ммоль) йодиду натрію. Реакційну суміш збовтували впродовж 4 годин при температурі 45°C. Потім реакційну суміш охолодили до кімнатної температури та концентрували у вакуумі. Осад розчинили у 100 мл етилацетату, промили соляним розчином і висушили над сульфатом магнію для одержання після концентрування 2,75 г жовтої олії. Дистилування дало 1,65 г (30%) чистого N-{{диметил(феніл)силіл}метил}циклопропанаміну у вигляді жовтої олії (M+H = 206). Т.к. (точка кипіння) = 120°C (0,1 мм р.с.).

Стадія 2: одержання N-циклопропіл-N-{{диметил(феніл)силіл}метил}-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду

При температурі докочинського середовища розчин 291 мг (1,65 ммоль) 5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбонілхлориду у 2 мл тетрагідрофурану додали краплями до розчину 300 мг (1,5 ммоль) N-{{диметил(феніл)силіл}метил} циклопропанаміну і 0,23 мл (1,65 ммоль) тріетиламіну в 4 мл тетрагідрофурану. Реакційну суміш збовтували впродовж 2 год. при температурі 70°C. Розчинник видалили у вакуумі, і потім додали 100 мл води до осаду. Водний шар двічі екстрагували етилацетатом (2 x 50 мл), і поєднані органічні шари послідовно промили 1 Н розчином HCl, насиченим розчином карбонату калію та соляним розчином і висушили над сульфатом магнію для одержання після концентрування 455 мг жовтої олії. Колонкова хроматографія на силікагелі (градієнт гептан/етилацетат) дала 340 мг (вихід: 60%) N-циклопропіл-N-{{диметил(феніл)силіл}метил}-5-фтор-1,3-диметил-1H-піразол-4-карбоксаміду у вигляді безбарвної олії (M = 345).

Приклад загального одержання: тонування амідів формули (I) на приладі Chemspeed

У пробірку об'ємом 13 мл відважили 0,27 ммоль фосфорного пентасульфід (P₂S₅). Додали 3 мл 0,18 молярного розчину амідів (I) (0,54 ммоль) в діоксані, і суміш нагрівали зі зворотним холодильником впродовж двох годин. Потім температуру охолодили до 80°C і додали 2,5 мл води. Суміш нагрівали до 80°C ще одну годину. Потім додали 2 мл води, і реакційну суміш двічі екстрагували 4 мл дихлорметану. Органічну фазу відклали на патрон лужного оксиду алюмінію (2 г) і двічі елюювали 8 мл дихлорметану. Розчинники видалили, і сиру похідну тіоамідів аналізували мас-спектроскопією рідинної хроматографії (MCPX) та ЯМР. Недостатньо чисті сполуки додатково очистили препаративною MCPX.

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

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилформамід

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

100%. Потім рослини поклали в інкубаторний ящик при температурі приблизно 20°C та відносній атмосферній вологості 96%.

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

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

Таблиця А

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
1	100	29	94	55	100
2	95	30	95	57	95
4	100	31	100	60	95
9	100	35	90	61	100
10	100	36	100	62	80
11	90	38	94	63	70
12	80	39	94	65	95
15	95	41	100	66	100
16	70	42	100	67	78
17	94	43	100	68	70
18	100	46	95	69	100
19	100	47	100	70	100
20	100	48	100	71	95
21	95	49	94	72	89
22	95	50	100	74	100
25	100	51	95	75	94
26	100	52	100	76	94
27	94	53	80		
28	100	54	95		

За цих умов спостерігали 90% боротьби із хворобою за допомогою сполуки 11 і 80% боротьби із хворобою за допомогою сполуки 12 за винаходом, тоді як зовсім ніякого захисту (0% боротьби із хворобою) не спостерігали при дозі 500 млн⁻¹ сполуки за прикладом 5, розкритим у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

Приклад 5, розкритий у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5, відповідає такій сполуці: N-циклогексил-N-{[диметил(феніл)силіл]метил}-2-фурамід.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближча сполука, розкрита у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

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

Розчинник: 24,5 частин за вагою ацетону
24,5 частин за вагою N,N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

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

Випробування оцінювали через 10 днів після інокулювання. 0% означало ефективність, що відповідала ефективності необроблених контрольних зразків, тоді як 100% ефективність

означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від високого (щонайменше 88%) до повного захисту при дозі 100 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці В:

Таблиця В

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
17	98	28	88	42	99
18	99	31	100	49	96
19	99	38	100	52	100
20	90	39	100	55	100
27	100	41	100		

Приклад С: Профілактичне випробування в умовах in vivo на *Botrytis cinerea* (боби)

Розчинник: 24,5 частин за вагою ацетону

24,5 частин за вагою N,N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

Для випробування захисної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки. Після висихання покриття, нанесеного обприскуванням, на кожний лист поклали 2 маленькі шматочки агару, покритого культурами сірої гнилі (*Botrytis cinerea*). Інокульовані рослини поклали у затемнену камеру при температурі 20°C та відносній атмосферній вологості 100%.

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

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

Таблиця С

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
19	100	38	95	52	100
27	98	41	98	55	100
31	95	42	100		

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

Розчинник: 49 частин за вагою of N,N-диметилацетамід

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

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

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

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

За цих умов спостерігали від високого (щонайменше 90%) до повного захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці D:

Таблиця D

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
4	93	27	100	42	100
9	100	28	100	48	100
10	100	30	100	49	94
17	94	31	100	51	80
18	100	32	100	51	95
19	100	38	100	52	100
20	100	39	94	55	100
21	100	41	95		

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

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

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

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

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

За цих умов спостерігали від високого (щонайменше 90%) до повного захисту при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці E:

Таблиця E

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
4	100	21	100	40	100
9	93	27	100	41	100
10	100	28	100	42	100
15	90	30	100	49	100
17	83	31	100	51	100
18	100	32	100	52	100
19	100	38	100	55	90
20	92	39	100		

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

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилформаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

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

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

Таблиця F

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
1	100	28	100	51	100
2	100	29	95	52	100
4	100	30	100	53	95
9	100	31	100	54	100
10	100	32	95	55	100
11	70	36	100	59	70
12	70	38	100	60	95
15	100	39	100	61	100
17	95	40	95	62	100
18	100	41	100	65	100
19	100	42	100	66	100
20	100	43	100	69	100
21	100	46	100	70	100
22	80	47	95	71	100
25	100	48	100	74	100
26	100	49	100	75	100
27	100	50	95	76	100

За цих умов спостерігали 70% боротьби з хворобою за допомогою сполуки 11 та сполуки 12 за винаходом, тоді як жодного захисту не спостерігали (0% боротьби із хворобою) у дозі 500 млн⁻¹ за допомогою сполуки за прикладом 5, розкритим у Gaodeng Xuexiao Huaхue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

Приклад 5, розкритий у Gaodeng Xuexiao Huaхue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5, відповідає такій сполуці: N-циклогексил-N-{[диметил(феніл)силіл]метил}-2-фурамід.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближча сполука, розкрита у Gaodeng Xuexiao Huaхue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

Приклад G: Захисне випробування в умовах in vivo на *Phakopsora pachyrhizi* (іржа сої)

Розчинник: 28,5 частин за вагою ацетону

Емульгатор: 1,5 частин за вагою поліоксіетиленалкілфенілового ефіру

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

Для випробування захисної активності молоді рослини обприскали препаратом активної сполуки при вказаній нормі нанесення. Через день після обприскування рослини інокулювали водною суспензією спор збудника хвороби іржі сої (*Phakopsora pachyrhizi*). Потім рослини помістили в теплицю при температурі приблизно 20°C та відносній атмосферній вологості приблизно 80%.

Випробування оцінювали через 11 днів після інокулювання. 0% означало ефективність, що відповідала ефективності контрольних зразків, тоді як 100% ефективність означала, що хвороби не спостерігали.

За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 80%) до повного захисту при дозі 250 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці G:

Таблиця G

Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність	Приклад	Ефективність
18	80	38	85		
31	100	52	99		

Приклад H: Профілактичне випробування в умовах *in vivo* на *Puccinia recondita* (пшениця)

Розчинник: 49 частин за вагою N,N-диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за вагою алкіларилполіглікольєфіру

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

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

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

За цих умов спостерігали 80% боротьби із хворобою зі сполукою 11 і 40% боротьби із хворобою зі сполукою 12 за винаходом, тоді як поганий захист (10% боротьби із хворобою) спостерігали у дозі 500 млн⁻¹ сполукою за прикладом 5, розкритим у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

Приклад 5, розкритий у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5, відповідає такій сполуці: N-циклогексил-N-{[диметил(феніл)силіл]метил}-2-фурамід.

Ці результати показують, що сполуки за винаходом мають набагато кращу біологічну активність, ніж структурно найближча сполука, розкрита у Gaodeng Xuexiao Huaxue Xuebao (1990), 11(10), 1072-5.

Приклад I: Випробування в умовах *in vivo* на *Puccinia recondita* (бура іржа пшениці)

Випробувані активні інгредієнти одержали гомогенізуванням у суміші ацетон/твін/ДМСО, потім розбавили водою для одержання бажаного активного матеріалу.

Рослини пшениці (сорт Scipion), висіяні у субстрат 50/50 торф - ґрунт-пуцолан у стартерних чашках і вирощені при температурі 12°C, обробили на стадії першого листа (10 см заввишки) обприскуванням описаною вище водною суспензією.

Рослини, які використовували як контрольні, обробили водним розчином без вмісту активного матеріалу.

Через 24 години рослини заразили обприскуванням листя водною суспензією спор *Puccinia recondita* (100 000 спор на мл). Спори зібрали із зараженої пшениці віком 10 днів та суспендували у воді із вмістом 2,5 мл/л 10%-го твіну 80. Заражені рослини пшениці інкубували впродовж 24 годин при температурі 20°C та 100%-ною відотною вологістю, а потім впродовж 10 днів при температурі 20°C та 70%-ній відносній вологості.

Сортування проводили через 10 днів після забруднення у порівнянні з контрольними рослинами.

За цих умов спостерігали добрий (щонайменше 70%) або повний захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками: 7.

Приклад J: Випробування в умовах *in vivo* на *Alternaria brassicae* (плямистість хрестоцвітних). Випробувані активні інгредієнти одержали гомогенізацією в суміші ацетон/твін/ДМСО, а потім розбавили водою для одержання бажаного активного матеріалу.

Рослини редису (сорт Pernet), висіяні у субстрат 50/50 торф - ґрунт-пуцолан у стартерних чашках і вирощені при температурі 18-20°C, обробили на стадії сім'ядолі обприскуванням активним інгредієнтом, одержаним, як описано вище.

Рослини, які використовували як контрольні, обробили сумішшю ацетон/твін/вода без вмісту активного матеріалу.

Через 24 години рослини заразили обприскуванням їх водною суспензією спор *Alternaria brassicae* (40 000 спор на см³). Спори зібрали з рослини віком від 12 до 13 днів.

Заражені рослини редису інкубували впродовж 6-7 днів при температурі близько 18°C у вологій атмосфері.

Сортування проводили через 6-7 днів після зараження у порівнянні з контрольними рослинами.

За цих умов спостерігали добрий (щонайменше 70%) захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками: 7 і 8.

Приклад К: Випробування в умовах *in vivo* на *Pyrenophora teres* (гельмінтоспоріоз ячменю)

Випробувані активні інгредієнти одержали гомогенізацією у суміші ацетон/твін/ДМСО, потім розбавили водою для одержання бажаної концентрації активного матеріалу.

Рослини ячменю (сорт Plaisant), висіяні у субстрат 50/50 торф - ґрунт-пуцолан у стартерних чашках і вирощені при температурі 12°C, обробили на стадії першого листа (10 см заввишки) обприскуванням активним інгредієнтом, одержаним, як описано вище.

Рослини, які використовували як контрольні, обробили водним розчином без вмісту активного матеріалу.

Через 24 години рослини заразили обприскуванням їх водною суспензією спор *Pyrenophora teres* (12000 спор на мл). Спори зібрали з рослини віком 12 днів. Заражені рослини ячменю інкубували впродовж 24 годин при температурі близько 20°C та 100%-ній відносній вологості, а потім впродовж 12 днів при 80%-ній відносній вологості.

Сортування проводили через 12 днів після зараження у порівнянні з контрольними рослинами.

За цих умов спостерігали добрий (щонайменше 70%) захист при дозі 500 ч./млн активного інгредієнта з такими сполуками: 7 і 8.

Приклад L: інгібування вироблення афлатоксинів *Aspergillus parasiticus*

Сполуки випробовували в титраційних мікропланшетах (96-лункових, чорних, з плоским і прозорим дном) в рідкому середовищі, що індукує афлатоксин (20 г цукрози, екстракт дріжджів 4 г, KH_2PO_4 1 г і $\text{MgSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ 0,5 г на літр), з додаванням 20 ммоль кавасолу (Cavasol) (гідроксипропіл-бета-циклодекстрину) та вмістом 1% DMSO. Аналіз розпочали інокулюванням середовища концентрованою суспензією спор *Aspergillus parasiticus* у кінцевій концентрації 1000 спор/мл.

Планшет накрили та інкубували при температурі 20°C впродовж 7 днів. Через 7 днів вирощування взяли вимірювання OD (оптичної щільності) при OD_{620nm} із кратним, розрахованим на лунку (коло: 4 x 4), за допомогою Infinite 1000 (Tecan) для обчислення інгібування росту. Одночасно взяли вимірювання флуоресценції дна при Em_{360nm} та Ex_{426nm} із кратним, розрахованим на лунку (квадрат: 3 x 3), для обчислення інгібування утворення афлатоксину.

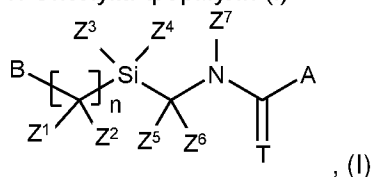
За цих умов спостерігали від доброго (щонайменше 80%) до повного інгібування вироблення афлатоксинів і від доброго (щонайменше 70%) до повного інгібування росту *Aspergillus parasiticus* при дозі 50 ммоль активного інгредієнта з такими сполуками з таблиці L:

Таблиця L

Приклад	% інгібування афлатоксину при 50 ммоль	% інгібування росту грибів при 50 ммоль	Приклад	% інгібування афлатоксину при 50 ммоль	% інгібування росту грибів при 50 ммоль
1	100	93	55	100	99
2	87	71	60	100	84
4	100	100	61	100	100
15	88	76	65	82	72
18	100	100	66	100	100
25	99	84	67	100	86
26	100	100	69	100	85
31	100	100	70	100	100
36	100	84	72	100	100
38	100	100	74	100	100
46	99	84	75	100	100
47	100	100	76	100	100
52	100	100			

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

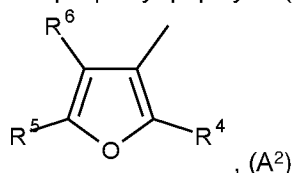
1. Сполука формули (I)



де

A вибирають з переліку, що складається з:

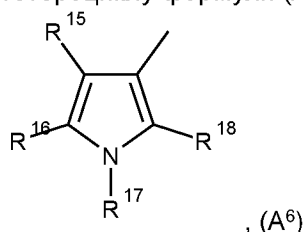
5 гетероциклу формули (A²)



де R⁴-R⁶, що можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, незаміщений C₁-C₅-алкіл,

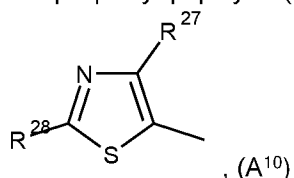
за умови, що A не є незаміщеним 2-фурильним кільцем,

10 гетероциклу формули (A⁶)



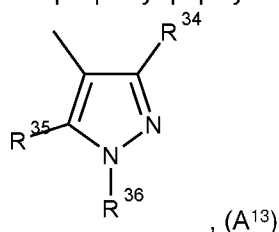
де R¹⁵, R¹⁶ і R¹⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, атом галогену, незаміщений C₁-C₆-алкіл, або C₁-C₆-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, що можуть бути однаковими або різними,

15 R¹⁷ означає атом водню або незаміщений C₁-C₅-алкіл, гетероциклу формули (A¹⁰)



де R²⁷ і R²⁸, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, атом галогену, незаміщений C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, що можуть

20 бути однаковими або різними, гетероциклу формули (A¹³)



де R³⁴ і R³⁵, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, атом галогену, незаміщений C₁-C₅-алкіл, C₁-C₆-галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, що можуть бути

25 однаковими або різними,

R³⁶ означає атом водню або незаміщений C₁-C₆-алкіл,

T означає O або S,

n означає 0 або 1,

В означає фенільне кільце, що може бути заміщене до 5 групами Х, які можуть бути однаковими або різними, або нафтильне кільце, що може бути заміщене до 7 групами Х, які можуть бути однаковими або різними,
Х означає атом галогену,

5 Z^1 і Z^2 означають атом водню,

Z^3 і Z^4 незалежно означають незаміщений C_1 - C_8 -алкіл,

Z^5 і Z^6 означають атом водню,

Z^7 означає атом водню, незаміщений C_1 - C_8 -алкіл або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл;

а також її солі та оптично-активні ізомери.

10 2. Сполука за п. 1, де А означає A^{13} , де R^{34} означає незаміщений C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеноалкіл, що містить до 9 атомів галогену, які можуть бути однаковими або різними; R^{35} означає атом водню або атом галогену і R^{36} означає незаміщений C_1 - C_5 -алкіл.

3. Сполука за будь-яким із пп. 1, 2, де Т означає О.

4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, де В означає заміщене або незаміщене фенільне кільце.

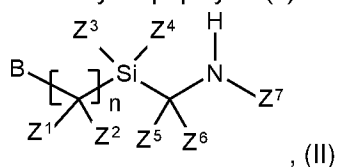
15 5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, де Z^7 означає атом водню або незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл.

6. Сполука за п. 5, де Z^7 означає незаміщений C_3 - C_7 -циклоалкіл.

7. Сполука за п. 7, де Z^7 означає циклопропіл.

20 8. Фунгіцидна композиція, яка містить як активний інгредієнт ефективну кількість сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-7 та прийнятні для сільського господарства підкладку, носій або наповнювач.

9. Сполука формули (II)



25 де В, n, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 і Z^6 є такими, як визначено у будь-якому з пп. 1-7, а Z^7 означає циклопропілну, циклобутильну, циклопентильну, циклогексильну або циклогептильну групу, за винятком N-{диметил-(феніл)силіл}метил}циклогексанаміну.

10. Спосіб боротьби із фітопатогенними грибами культур рослин, який **відрізняється** тим, що агрономічно ефективну і по суті нефітотоксичну кількість сполуки за будь-яким із пп. 1-7 або композицію за п. 8 наносять на ґрунт, де ростуть рослини або де вони можуть рости, на листя та/або плоди рослин або насіння рослин.

30