



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 131020

(13) C2

(51) МПК

C07D 417/14 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

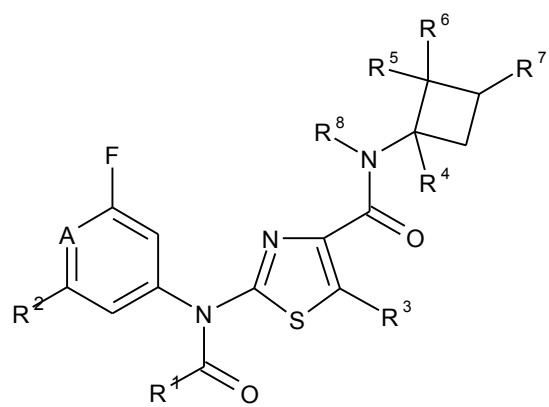
(21) Номер заявки:	а 2022 05077	(72) Винахідник(и):	Едмундс Ендрю (СН)
(22) Дата подання заявки:	27.05.2021	(73) Володілець (володільці):	СІНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ, Rosentalstrasse 67, 4058 Basel, Switzerland (СН)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	16.07.2026	(74) Представник:	Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	20178038.4	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2020/109511 A1, 04.06.2020 WO 2019/105933 A1, 06.06.2019 WO 2010/012793 A1, 04.02.2010 WO 2017/207362 A1, 07.12.2017
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	03.06.2020		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	EP		
(41) Публікація відомостей про заявку:	14.06.2023, Бюл.№ 24		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	15.07.2026, Бюл.№ 28		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	РСТ/EP2021/064263, 27.05.2021		

(54) МІКРОБІОЦИДНІ ПОХІДНІ

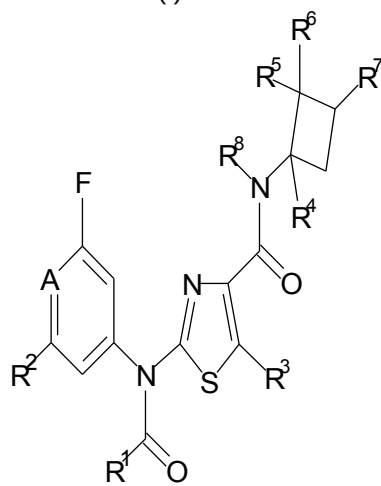
(57) Реферат:

Сполука формули (I), де замісники є такими, як визначено в пункті 1, корисні як пестициди, і особливо фунгіциди.

UA 131020 C2



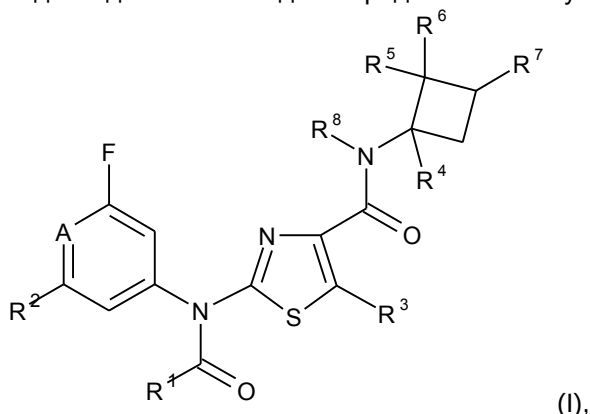
. (I)



Даний винахід стосується тiazольних похідних, що характеризуються мікробіоцидною активністю, наприклад таких як активні інгредієнти, які характеризуються мікробіоцидною активністю, зокрема фунгіцидною активністю. Даний винахід також стосується одержання таких тiazольних похідних, агрохімічних композицій, що містять щонайменше одну з тiazольних похідних, і варіантів застосування тiazольних похідних або композицій на їхній основі у сільському господарстві або садівництві для контролю або попередження зараження рослин, зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, насіння або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибами.

У WO 2010/012793 та WO 2017/207362 описані тiazольні похідні як пестицидні засоби.

Згідно з даним винаходом передбачена сполука формули (I),



де

A являє собою C-H або N;

R¹ являє собою C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₆алкілсульфанілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфінілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфонілC₁-C₆алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки;

R² являє собою водень або галоген;

R³ являє собою C₁-C₈алкіл;

кожен з R⁴, R⁵, R⁶ незалежно являє собою водень або C₁-C₄алкіл;

R⁷ являє собою водень, C₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл або C₁-C₆алкокси;

R⁸ являє собою водень, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкілсульфанілC₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкілсульфінілC₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкілсульфонілC₁-C₆алкілкарбоніл або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки;

або її сіль або N-оксид.

Згідно з другим аспектом даного винаходу передбачена агрохімічна композиція, що містить фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) згідно з даним винаходом. Така композиція, яка застосовується у сільському господарстві, може додатково містити щонайменше один додатковий активний інгредієнт та/або агрохімічно прийнятний розріджувач або носій.

Згідно з третім аспектом даного винаходу передбачений спосіб контролю або попередження зараження корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, де фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) або композиції, що містить дану сполуку як активний інгредієнт, застосовують щодо рослин, їхніх частин або їхнього місця зростання.

Згідно з четвертим аспектом даного винаходу передбачене застосування сполуки формули (I) як фунгіциду. Згідно з даним конкретним аспектом даного винаходу застосування може включати або може не включати способи лікування організму людини або тварини шляхом хірургічного втручання або терапії.

Застосовуваний у даному документі термін "галоген" стосується фтору (фторо), хлору (хлоро), броду (бромо) або йоду (йодо).

Застосовуваний у даному документі термін "C₁-C₈алкіл" означає радикал із прямим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, який складається лише з атомів вуглецю та водню, не містить ненасичених зв'язків, містить від одного до восьми атомів вуглецю та який приєднаний до решти молекули одинарним зв'язком. "C₁-C₆алкіл", "C₁-C₄алкіл" та "C₁-C₃алкіл" слід розуміти відповідним чином. Приклади C₁-C₈алкілу включають без обмеження метил, етил, н-пропіл та їхні ізомери, наприклад ізопропіл. Група "C₁-C₆алкілен" стосується відповідного визначення C₁-

С₆алкілу, за винятком того, що такий радикал приєднаний до решти молекули двома одинарними зв'язками.

Застосовуваний у даному документі термін "С₁-С₆алкокси" стосується радикала формули -OR_a, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище. Терміни "С₁-С₄алкокси" і "С₁-С₃алкокси" слід розуміти відповідним чином. Приклади С₁-С₆алкокси включають без обмеження метокси, етокси, 1-метилетокси (ізопропокси) та пропокси.

Застосовуваний у даному документі термін "С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкіл" стосується радикала формули R_bOR_a-, де R_b являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_a являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище. "С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкіл", "С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкіл", "С₁-С₄алкоксиС₁-С₃алкіл", "С₁-С₄алкоксиС₁-С₂алкіл" і "С₃-С₄алкоксиС₁-С₂алкіл" слід розуміти відповідним чином. Приклади С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкілу включають без обмеження ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиетил, 1-трет-бутоксиетил.

Застосовуваний у даному документі термін "С₁-С₆алкоксикарбоніл" стосується радикала формули R_aOC(O)-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище. "С₁-С₄алкоксикарбоніл" і "С₁-С₃алкоксикарбоніл" слід розуміти відповідним чином.

Застосовуваний у даному документі термін "С₁-С₆алкоксикарбонілС₁-С₄алкіл" стосується радикала формули R_aOC(O)R_b-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_b являє собою С₁-С₄алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкілкарбоніл" стосується радикала формули R_aOR_bC(O)-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкілсульфанілС₁-С₆алкіл" стосується радикала формули R_aSR_b-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкілсульфінілС₁-С₆алкіл" стосується радикала формули R_aS(O)R_b-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкілсульфанілС₁-С₆алкілкарбоніл" стосується радикала формули R_aSR_bC(O)-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкілсульфінілС₁-С₆алкілкарбоніл" стосується радикала формули R_aS(O)R_bC(O)-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Використовуваний в даному документі термін "С₁-С₆алкілсульфонілС₁-С₆алкілкарбоніл" стосується радикала формули R_aS(O)₂R_bC(O)-, де R_a являє собою С₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, і R_b являє собою С₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

Застосовуваний у даному документі термін "гетероциклі" стосується стабільного 4-, 5- або 6-членного неароматичного моноциклічного кільця, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, при цьому гетероатоми окремо вибрані з азоту, кисню та сірки. Гетероциклічний радикал може бути зв'язаний із рештою молекули за допомогою атома вуглецю або гетероатома. Приклади гетероциклілу включають без обмеження азиридиніл, азетидиніл, оксетаніл, тіетаніл, тетрагідрофурил, піролідиніл, піразолідиніл, імідазолідиніл, піперидиніл, піперазиніл, морфолініл, діоксоланіл, дитіоланіл та тiazолідиніл.

Використовуваний в даному документі термін "гетероциклілкарбоніл" стосується радикала формули R_aC(O)-, де R_a являє собою гетероциклічний фрагмент, як визначено вище.

Наявність одного або декількох можливих асиметричних атомів вуглецю в сполуці формули (I) означає, що сполуки можуть зустрічатися в оптично ізомерних формах, тобто енантіомерних або діастереомерних формах. Також можуть зустрічатися атропоізомери в результаті обмеженого обертання навколо одинарного зв'язку. Передбачається, що формула (I) включає всі такі можливі ізомерні форми та їх суміші. Даний винахід включає всі такі можливі ізомерні форми сполуки формули (I) та їх суміші. Аналогічно передбачається, що формула (I) включає всі можливі таутомери. Даний винахід включає всі можливі таутомерні форми для сполуки формули (I).

У кожному разі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом знаходяться у вільній формі, в окисненій формі у вигляді N-оксиду або у формі солі, наприклад у формі солі, застосовної у сільському господарстві.

5 N-оксиди являють собою окиснені форми третинних амінів або окиснені форми азотовмісних гетероароматичних сполук. Вони описані, наприклад, у книзі "Heterocyclic N-oxides", A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton (1991).

У наступному переліку представлені визначення, включаючи переважні визначення, для замісників A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ і R⁸ із посиланням на сполуки формули (I). Стосовно будь-якого з цих замісників будь-яке з визначень, наведених нижче, можна комбінувати з будь-яким визначенням будь-якого іншого замісника, наведеним нижче або в інших частинах даного документа.

A являє собою C-H або N. В одній групі варіантів здійснення A являє собою C-H. В іншій групі варіантів здійснення A являє собою N.

15 R¹ являє собою C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₆алкілсульфанілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфінілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфонілC₁-C₆алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

20 Переважно R¹ являє собою C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

25 Більш переважно R¹ являє собою C₁-C₃алкоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню.

30 Ще більш переважно R¹ являє собою C₃-C₄алкоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

35 Ще більш переважно R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиметил, 1-трет-бутоксиметил, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

В додатковому переважному варіанті здійснення R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиметил, 1-трет-бутоксиметил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл або тетрагідропіран-4-іл.

40 В одному варіанті здійснення R¹ являє собою C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфанілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфінілC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкілсульфонілC₁-C₆алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

45 Переважно R¹ являє собою C₁-C₄алкоксиC₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкілсульфанілC₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкілсульфінілC₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкілсульфонілC₁-C₄алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

Більш переважно R¹ являє собою C₁-C₄алкоксиC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

50 Ще більш переважно R¹ являє собою C₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфанілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфінілC₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкілсульфонілC₁-C₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню.

55 Ще більш переважно R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиметил, 1-трет-бутоксиметил, 1-метилсульфанілетил, 1-метилсульфінілетил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл.

Найбільш переважно R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиметил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл.

В одній групі варіантів здійснення R^1 являє собою C_1 - C_6 алкілсульфаніл C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфініл C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл C_1 - C_6 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

5 В іншій групі варіантів здійснення R^1 являє собою C_1 - C_4 алкілсульфаніл C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкілсульфініл C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкілсульфоніл C_1 - C_4 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

10 В додатковій групі варіантів здійснення R^1 являє собою C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

15 В додатковій групі варіантів здійснення R^1 являє собою C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

20 В ще більш додатковій групі варіантів здійснення R^1 являє собою C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню.

В переважній групі варіантів здійснення R^1 являє собою 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл або тетрагідропіран-4-іл.

25 В більш переважній групі варіантів здійснення R^1 являє собою 1-метилсульфанілетил, 1-метилсульфінілетил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл.

В найбільш переважній групі варіантів здійснення R^1 являє собою 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл.

30 В додатковій групі переважних варіантів здійснення R^1 являє собою C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.

35 Переважно R^1 являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-ізопропоксиетил, 1-трет-бутоксиетил, 1-метилсульфанілетил, 1-метилсульфінілетил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл. Більш переважно R^1 являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-ізопропоксиетил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл або тетрагідрофуран-3-іл.

R^2 являє собою водень або галоген. Переважно R^2 являє собою водень, хлор, бром або фтор. Більш переважно R^2 являє собою водень або фтор. В одній групі варіантів здійснення R^2 являє собою водень. В додатковій групі варіантів здійснення R^2 являє собою фтор.

40 R^3 являє собою C_1 - C_6 алкіл. Переважно R^3 являє собою C_1 - C_6 алкіл. Більш переважно R^3 являє собою C_1 - C_3 алкіл. Ще більш переважно R^3 являє собою метил, етил або ізопропіл. Найбільш переважно R^3 являє собою метил.

45 Кожен з R^4 , R^5 , R^6 незалежно являє собою водень або C_1 - C_4 алкіл. Переважно кожен з R^4 , R^5 , R^6 незалежно являє собою водень або C_1 - C_3 алкіл. Більш переважно кожен з R^4 , R^5 , R^6 незалежно являє собою водень або метил.

В одній групі варіантів здійснення R^4 являє собою водень, і обидва R^5 і R^6 являють собою метил.

50 R^7 являє собою водень, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл або C_1 - C_6 алкокси. Переважно R^7 являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_4 алкоксикарбоніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_4 алкоксикарбоніл або C_1 - C_4 алкокси. Більш переважно R^7 являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкоксикарбоніл C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_3 алкоксикарбоніл або C_1 - C_3 алкокси. Ще більш переважно R^7 являє собою водень, метил, метоксикарбонілметил, метоксикарбоніл або метокси. Ще більш переважно R^7 являє собою водень або метил, найбільш переважно R^7 являє собою водень.

55 R^8 являє собою водень, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфаніл C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл C_1 - C_6 алкілкарбоніл або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

Переважно R^8 являє собою водень, C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_4 алкілкарбоніл, C_1 - C_4 алкілсульфаніл C_1 - C_4 алкілкарбоніл, C_1 - C_4 алкілсульфініл C_1 - C_4 алкілкарбоніл, C_1 - C_4 алкілсульфоніл C_1 - C_4 алкілкарбоніл або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2

гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки.

Більш переважно R^8 являє собою водень, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкілкарбоніл, C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкілкарбоніл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкілкарбоніл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкілкарбоніл або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2

гетероатоми, окремо вибрані з азоту і кисню.
Ще більш переважно R^8 являє собою водень або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню.

Ще більш переважно R^8 являє собою водень або тетрагідрофуран-3-карбоніл. Найбільш переважно R^8 являє собою водень.

У сполуці формули (I) за даним винаходом переважно

A являє собою C-H або N;

R^1 являє собою C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню;

R^2 являє собою водень або фтор;

R^3 являє собою метил;

кожен з R^4 , R^5 і R^6 незалежно являє собою водень або метил;

R^7 являє собою водень; і

R^8 являє собою водень або гетероциклілкарбоніл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню.

Більш переважно A являє собою N;

R^1 являє собою C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню;

R^2 являє собою водень або фтор;

R^3 являє собою метил;

кожен з R^4 , R^5 і R^6 незалежно являє собою водень або метил;

R^7 являє собою водень; і

R^8 являє собою водень або тетрагідрофураніл.

Ще більш переважно A являє собою N;

R^1 являє собою C_1 - C_3 алкілсульфаніл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфініл C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкілсульфоніл C_1 - C_3 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4- або 5-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить один атом кисню;

R^2 являє собою водень або фтор;

R^3 являє собою метил;

R^4 являє собою водень;

R^5 і R^6 одночасно являють собою метил;

R^7 являє собою водень; і

R^8 являє собою водень.

В додатковій групі переважних варіантів здійснення в сполуці формули (I) згідно з даним винаходом переважно A являє собою N;

R^1 являє собою C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфаніл C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфініл C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл C_1 - C_6 алкіл або гетероцикліл, де гетероциклільний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки;

R^2 являє собою водень або фтор;

R^3 являє собою метил;

R^4 являє собою водень;

R^5 і R^6 одночасно являють собою метил;

R^7 являє собою водень; і

R^8 являє собою водень.

Більш переважно A являє собою N;

R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиетил, 1-ізопропоксиетил, 1-трет-бутоксиметил, C₁-С₃алкілсульфанілC₁-С₃алкіл, C₁-С₃алкілсульфінілC₁-С₃алкіл, C₁-С₃алкілсульфонілC₁-С₃алкіл або гетероциклі, де гетероциклічний фрагмент являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо

вибрані з азоту і кисню;
R² являє собою водень або фтор;
R³ являє собою метил;
R⁴ являє собою водень;
R⁵ і R⁶ одночасно являють собою метил;
R⁷ являє собою водень; і
R⁸ являє собою водень.

Переважаю сполука формули (I) вибрана з наступного:

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)тіазол-4-карбоксамід (P-1);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-2);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-3);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(оксетан-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-4);

2-[2-трет-бутоксипропаноіл-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-5);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксипропаноіл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-6);

2-[(2-трет-бутоксіяцетил)-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-7);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксіяцетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-8);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метоксипропаноіл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-9);

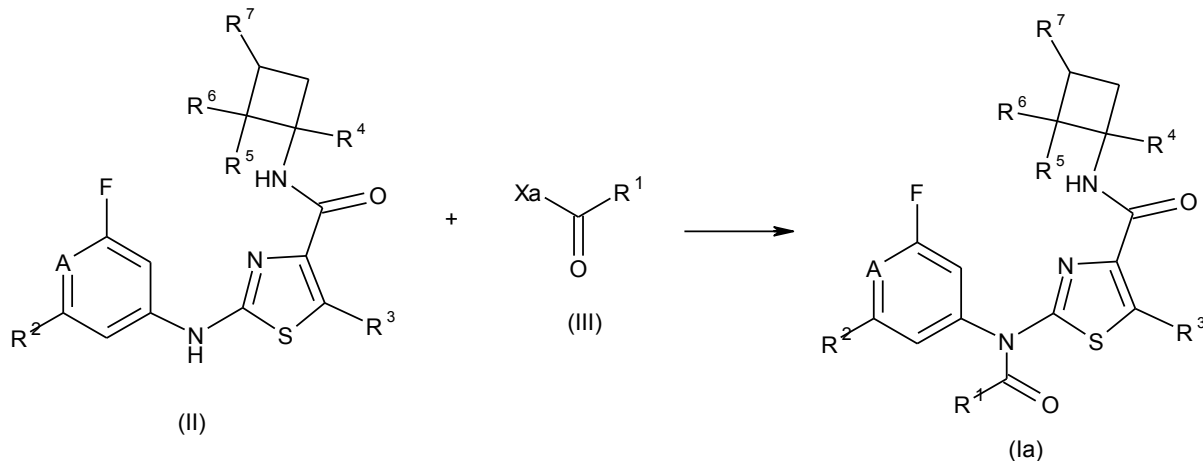
2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метилсульфонілпропаноіл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-10) і

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідропіран-4-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (P-11).

Сполуки за даним винаходом можуть бути одержані, як показано на наступних схемах, на яких, якщо не вказано інше, визначення кожної змінної є таким, як визначено вище для сполуки формули (I).

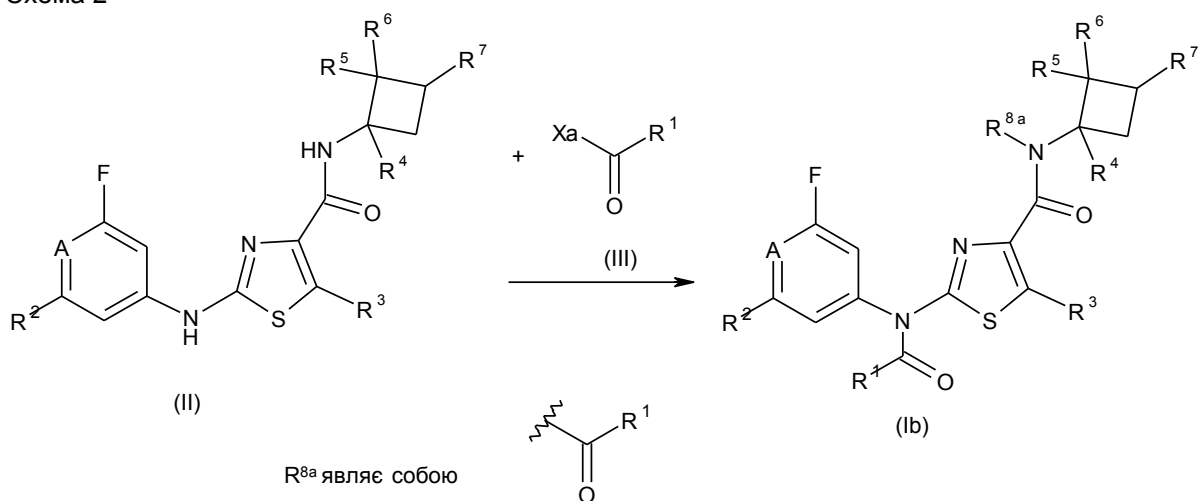
Сполуки формули (Ia) згідно з даним винаходом, де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ є такими, як визначено для формули (I), і R⁸ являє собою водень, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (II), де A, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (III), де R¹ є таким, як визначено для формули (I), і Ха являє собою галоген, переважно бром або хлор, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 1 (нижче).

Схема 1



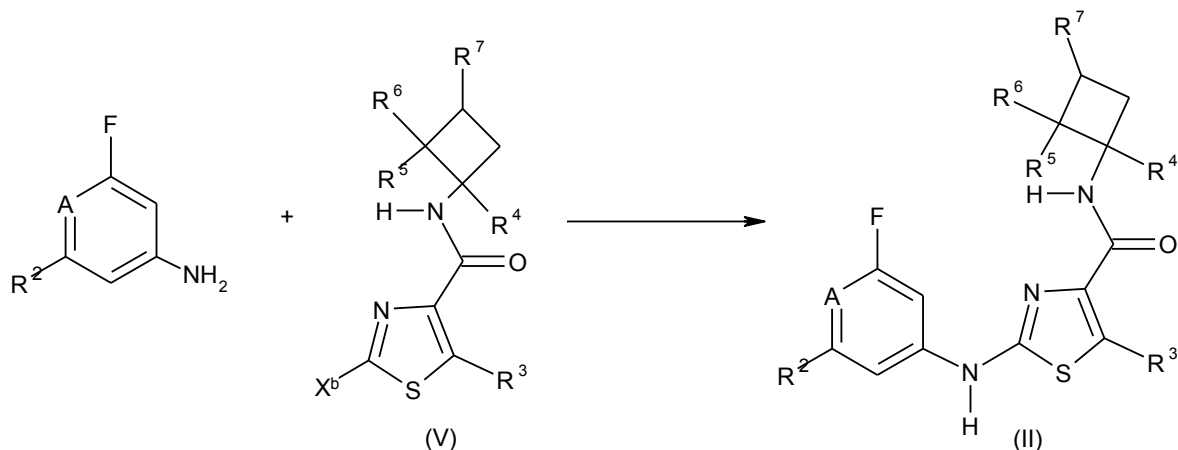
Фахівці в даній галузі техніки розуміють, що умови, застосовувані для одержання сполук формули (Ia), будуть залежати від стехіометрії реакції. Наприклад, здійснення реакції 1-1,5 еквівалентів сполук формули (III) з 1 еквівалентом сполук формули (II) призведе до одержання переважно сполук формули (Ia), при цьому здійснення реакції 2-2,1 еквівалентів сполук формули (III) з 1 еквівалентом сполук формули (II) призведе до утворення сполук формули (Ib), де R^{8a} являє собою C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфаніл C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл C_1 - C_6 алкілкарбоніл або гетероциклікарбоніл, де гетероциклі являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню і сірки. Це проілюстровано на схемі 2 (нижче).

Схема 2



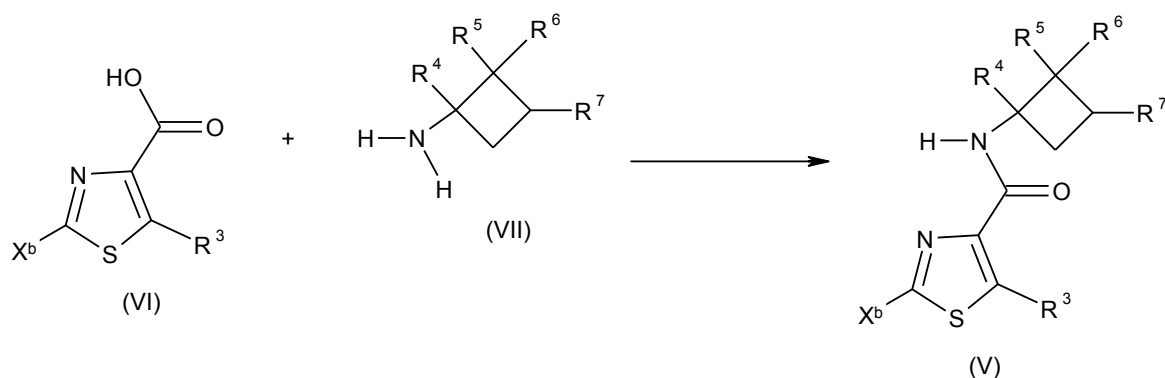
Сполуки формули (II), де A, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IV), де A або R^2 є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (V), де R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), і Xb являє собою галоген, переважно бром або хлор, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або в умовах каталізованого перехідним металом амінування Бухвальда-Гартвіга. Це показано на схемі 3 (нижче). Такі сполуки формули (II) були описані в WO 2019/105933.

Схема 3



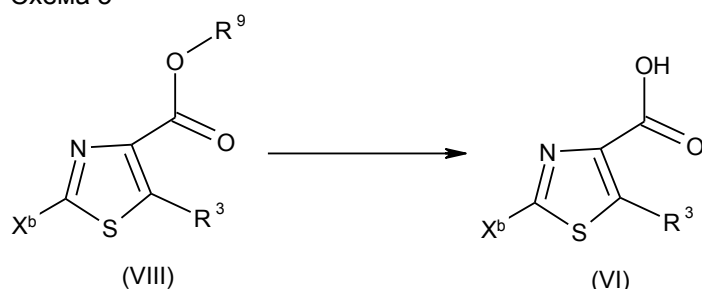
Сполуки формули (V), де R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), і Xb являє собою галоген, переважно бром або хлор, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (VI), де R^2 є таким, як визначено для формули (I) і Xb являє собою галоген, переважно бром, і сполуки формули (VII), де R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), або шляхом застосування проміжного хлорангідриду, або безпосередньо за допомогою засобу для утворення пептидного зв'язку. Це показано на схемі 4 (нижче).

Схема 4



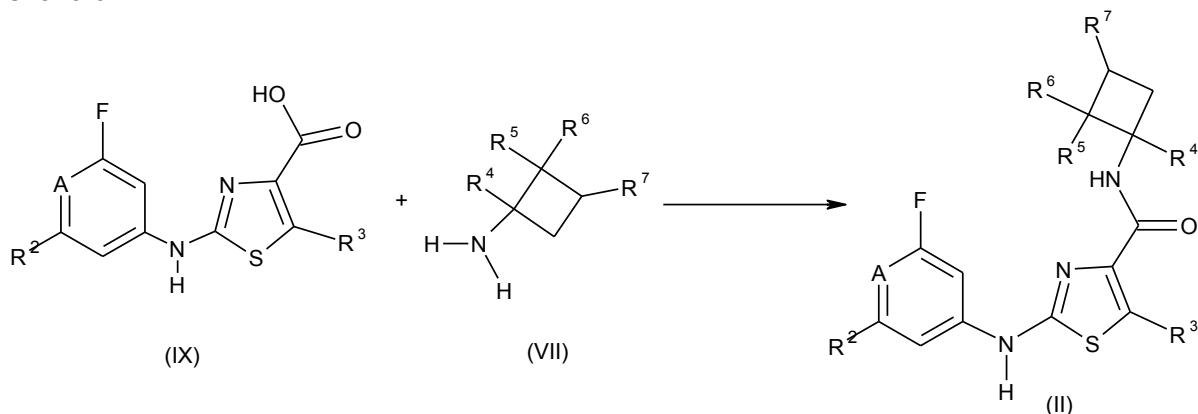
Сполуки формули (VI), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), і X^b являє собою галоген, переважно бром або хлор, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (VIII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), X^b являє собою галоген, переважно бром або хлор, і R^9 являє собою C_1 - C_6 алкіл, за допомогою основи. Це показано на схемі 5 (нижче).

Схема 5



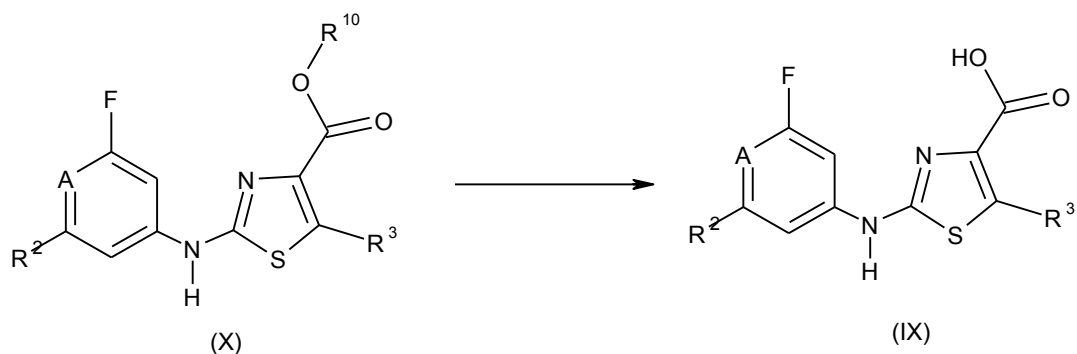
Альтернативно сполуки формули (II), де R^2 і A є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IX), де R^2 , R^3 і A є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (VII), де R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), або шляхом застосування проміжного хлорангідриду, або безпосередньо за допомогою засобу для утворення пептидного зв'язку. Це показано на схемі 6 (нижче).

Схема 6



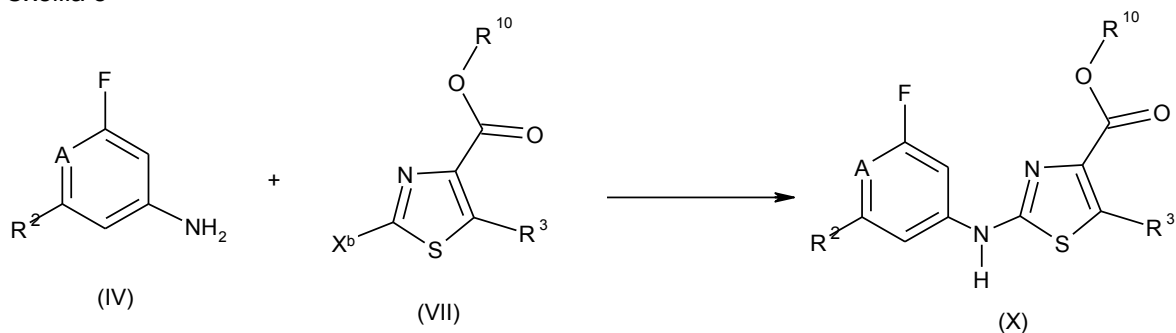
Сполуки формули (IX), де R^2 , A і R^3 є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (X), де R^2 , R^3 і A є такими, як визначено для формули (I), і R^{10} являє собою C_1 - C_6 алкіл, за допомогою основи. Це показано на схемі 7 (нижче).

Схема 7



Сполуки формули (X), де R^2 , A і R^3 є такими, як визначено для формули (I), і R^{10} являє собою C_1 - C_6 алкіл, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IV), де A і R^2 є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (VII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), X^b являє собою галоген, переважно бром або хлор, і R^{10} являє собою C_1 - C_6 алкіл, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або при умовах каталізованого перехідним металом амінування Бухвальда-Гартвіга. Це показано на схемі 8 (нижче).

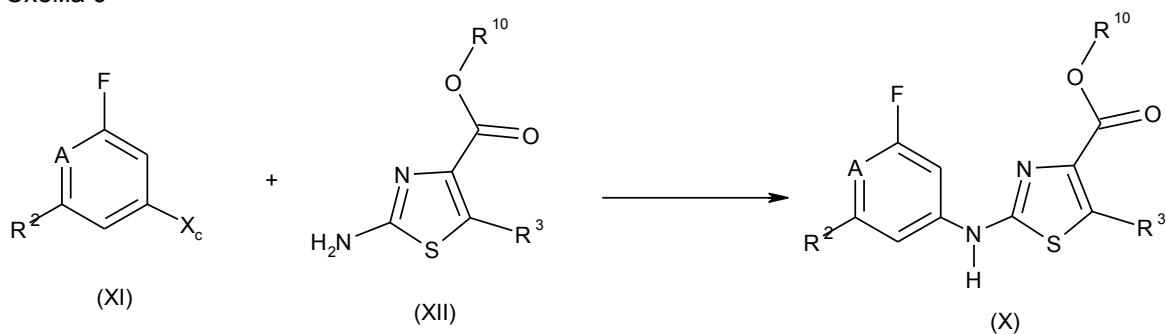
Схема 8



10

Альтернативно сполуки формули (X), де R^2 , A і R^3 є такими, як визначено для формули (I), і R^{10} являє собою C_1 - C_6 алкіл, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XI), де R^2 і A є такими, як визначено для формули (I), і X^c являє собою галоген, переважно бром або йод, за допомогою сполуки формули (XII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), і R^{10} являє собою C_1 - C_6 алкіл, в умовах каталізованого перехідним металом амінування Бухвальда-Гартвіга. Це показано на схемі 9 (нижче).

Схема 9

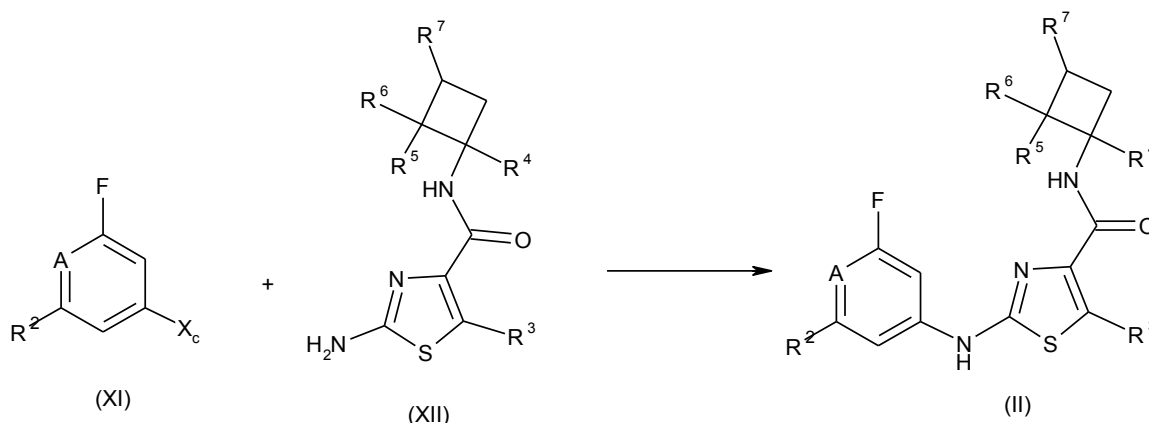


20

Альтернативно сполуки формули (II), де A, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XI), де A і R^2 є такими, як визначено для формули (I), і X^c являє собою галоген, переважно бром або йод, за допомогою сполуки формули (XIII), де R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 є такими, як визначено для формули (I), або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або в умовах каталізованого перехідним металом амінування Бухвальда-Гартвіга. Це показано на схемі 10 (нижче).

Схема 10

25



Несподівано на сьогодні було виявлено, що нові сполуки формули (I) характеризуються для практичних цілей дуже ефективним рівнем біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинених грибами.

5 Сполуки формули (I) можна застосовувати в сільському господарстві та пов'язаних із ним галузях застосування, наприклад, як активні інгредієнти для контролю шкідників рослин або на неживих матеріалах для контролю мікроорганізмів, що спричиняють псування, або організмів, потенційно шкідливих для людини. Нові сполуки відрізняються відмінною активністю за низьких норм застосування, при цьому вони добре переносяться рослинами та є безпечними для
 10 навколишнього середовища. Вони характеризуються дуже корисними лікувальними, профілактичними і системними властивостями, та їх можна застосовувати для захисту численних культивованих рослин. Сполуки формули (I) можна застосовувати для пригнічення або знищення шкідників, які зустрічаються на рослинах або частинах рослин (плодах, квітках, листках, стеблах, бульбах, коренях) різних сільськогосподарських культур корисних рослин, а
 15 також захищаючи водночас ті частини рослин, які виростають пізніше, наприклад, від фітопатогенних мікроорганізмів.

Даний винахід додатково стосується способу контролю або попередження зараження рослин або матеріалу для розмноження рослин та/або зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, сприйнятливих до зараження мікроорганізмами, шляхом
 20 обробки рослин або матеріалу для розмноження рослин та/або зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, де ефективну кількість сполуки формули (I) застосовують щодо рослин, їхніх частин або їхнього місця зростання.

Також сполуки формули (I) можна застосовувати як фунгіцид. Застосовуваний у даному документі термін "фунгіцид" означає сполуку, за допомогою якої контролюють, модифікують або
 25 попереджують ріст грибів. Термін "фунгіцидно ефективна кількість" означає кількість такої сполуки або комбінації таких сполук, що здатна впливати на ріст грибів. Ефекти контролю або модифікації включають усі відхилення від природного розвитку, такі як знищення, гальмування розвитку тощо, а попередження включає бар'єр або інше захисне утворення в рослині або на ній для попередження грибкової інфекції.

30 Також сполуки формули (I) можна застосовувати як засоби для протравлювання з метою обробки матеріалу для розмноження рослин, наприклад насіння, наприклад плодів, бульб або зерен або паростків рослини (наприклад, рису) для захисту від грибкових інфекцій, а також від фітопатогенних грибів, що зустрічаються в ґрунті. Матеріал для розмноження можна обробляти композицією, що містить сполуку формули (I), перед висадженням: насінину, наприклад, можна протравити перед висіванням.
 35

Активні інгредієнти згідно з даним винаходом також можна застосовувати щодо зерен (нанесення покриття) або шляхом просочування насіння у рідкому складі, або шляхом покривання їх твердим складом. Композицію також можна застосовувати щодо місця посадки під час садження матеріалу для розмноження, наприклад щодо борозни для насіння під час висівання. Даний винахід також стосується таких способів обробки матеріалу для розмноження рослин та обробленого у такий спосіб матеріалу для розмноження рослин.
 40

Додатково сполуки згідно з даним винаходом можна застосовувати для контролю грибів у суміжних галузях, наприклад, у галузі захисту технічних матеріалів, включаючи дерев'яні та пов'язані з деревом технічні продукти, у галузі зберігання продуктів харчування, у галузі організації санітарної обробки.
 45

Крім того, даний винахід можна застосовувати для захисту неживих матеріалів від ураження грибами, наприклад пиломатеріалів, личкувальних плит і фарби.

Сполуки формули (I) можуть бути, наприклад, ефективними щодо грибів і збудників захворювань, що належать до грибів, а також щодо фітопатогенних бактерій і вірусів. Ці гриби і збудники захворювань, що належать до грибів, а також фітопатогенні бактерії та віруси являють собою, наприклад:

- 5 *Absidia corymbifera*, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp. в тому числі *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium* spp. в тому числі *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp. в тому числі *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp. в тому числі *B. cinerea*, *Candida* spp. в тому числі *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitanae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephalosporium fragrans*,
10 *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp. в тому числі *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp. в тому числі *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe* spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp. в тому числі *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp. в тому числі *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*,
15 *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium musarum*, *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Helminthosporium* spp, *Hemileia* spp, *Histoplasma* spp. в тому числі *H. capsulatum*, *Laetisaria fuciformis*, *Leptographium lindbergii*, *Leveillula taurica*, *Lophodermium seeditiosum*, *Microdochium nivale*, *Microsporium* spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp,
20 *Mycosphaerella* spp. в тому числі *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium theobromaeon*, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp, *Penicillium* spp. в тому числі *P. digitatum*, *P. italicum*, *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp. в тому числі *P. maydis*, *P. philippinensis* и *P. sorghi*, *Peronospora* spp, *Phaeosphaeria nodorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus igniarius*, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*, *Phytophthora* spp. в тому числі *P. infestans*, *Plasmopara* spp. в тому числі *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp. в тому числі *P. leucotricha*,
25 *Polomyxa graminis*, *Polomyxa betae*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp. в тому числі *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* spp. в тому числі *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. tritici*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp. в тому числі *P. oryzae*, *Pythium* spp. в тому числі *P. ultimum*, *Ramularia* spp,
30 *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. в тому числі *S. apiospermum* и *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*,
 Sclerotinia spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, в тому числі *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp,
35 *Trichoderma* spp., в тому числі *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. в тому числі *V. inaequalis*, *Verticillium* spp, и *Xanthomonas* spp.

- В обсязі даного винаходу цільові сільськогосподарські культури та/або корисні рослини, що підлягають захисту, звичайно включають багаторічні й однорічні сільськогосподарські культури, такі як ягідні рослини, наприклад різновиди ожини, чорниці, журавлини, малини та полуниці; зернові, наприклад ячмінь, маїс (кукурудза), просо, різновиди вівса, рис, жито, сорго, тритикале та пшениця; волокнисті рослини, наприклад бавовник, льон, коноплі, джут та сизаль; польові сільськогосподарські культури, наприклад цукровий і кормовий буряк, кавове дерево, різновиди хмелю, гірчиця, олійний ріпак (канола), мак, цукрова тростина, соняшник, чайний кущ і тютюн; фруктові дерева, наприклад яблуня, абрикос, авокадо, банан, вишня, цитрус, нектарин, персик, груша та слива; злакові трави, наприклад бермудська трава, тонконіг, мітлиця, еремохля змієхвоста, костриця, пажитниця, августинова трава та цойсія японська; ароматичні трави, такі як базилік, бурачник, шніт-цибуля, коріандр, лаванда, любисток, м'ята, орегано, петрушка, розмарин, шавлія та чебрець; бобові, наприклад різновиди квасолі, сочевиці, гороху та сої; горіхи, наприклад мигдаль, кеш'ю, земляний горіх, ліщина, арахіс, пекан, фісташкове дерево та волосський горіх; пальми, наприклад олійна пальма; декоративні рослини, наприклад квіти, чагарники та дерева; інші дерева, наприклад какао-дерево, кокосова пальма, оливкове дерево та каучукове дерево; овочі, наприклад спаржа, баклажан, броколі, капуста, морква, огірок, часник, салат-латук, кабачок, диня, окра, цибуля ріпчаста, перець, картопля, гарбуз, ревінь, шпинат і томат; а також виноградні, наприклад різновиди винограду.
- 50 Термін "корисні рослини" слід розуміти як такий, що включає також корисні рослини, яким була надана толерантність до гербіцидів, таких як бромексиніл, або класів гербіцидів (таких як, наприклад, інгібітори HPPD, інгібітори ALS, наприклад примісульфурон, просульфурон і трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енол-піровіл-шикімат-3-фосфатсинтази), інгібітори GS (глутамінсинтетази) або інгібітори PPO (протопорфіриногеноксидази)) у результаті

традиційних способів селекції або генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури, якій була надана толерантність до імідазолінонів, наприклад імазамоксу, за допомогою традиційних способів селекції (мутагенезу), є суріпиця Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким була надана толерантність до гербіцидів або класів гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають стійкі до гліфосату і глюфосинату сорти маїсу, комерційно доступні під торговими назвами RoundupReady®, Herculex I® і LibertyLink®.

Термін "корисні рослини" треба розуміти також як такий, що включає корисні рослини, які були трансформовані за допомогою застосування методик із застосуванням рекомбінантних ДНК таким чином, що вони стали здатними синтезувати один або декілька токсинів вибіркової дії, таких як відомі, наприклад, у токсиноутворювальних бактерій, особливо бактерій роду *Bacillus*.

Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry(IA)(b)); YieldGard Rootworm® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry(IA)(b) і токсин CryIIIB(b1)); Starlink® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIF(a2) і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) для забезпечення толерантності до гербіциду глюфосинату амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry(IA)(c)); Bollgard I® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry(IA)(c)); Bollgard II® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry(IA)(c) і токсин CryI(IA)(b)); VIPCOT® (сорт бавовнику, що експресує токсин VIP); NewLeaf® (сорт картоплі, що експресує токсин CryII(IA)); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 з ознакою толерантності до гліфосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 з ознакою стійкості до кукурудзяного метелика (CB)), Agrisure® RW (з ознакою стійкості до кукурудзяного метелика) і Protecta®.

Термін "сільськогосподарські культури" слід розуміти як такий, що включає також культурні рослини, які були трансформовані за допомогою методик із застосуванням рекомбінантних ДНК таким чином, що вони стали здатними синтезувати один або декілька токсинів вибіркової дії, таких як відомі, наприклад, у токсиноутворювальних бактерій, особливо бактерій роду *Bacillus*.

Токсини, які можуть бути експресовані такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, інсектицидні білки із *Bacillus cereus* або *Bacillus popilliae*; або інсектицидні білки із *Bacillus thuringiensis*, такі як δ -ендотоксини, наприклад, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 або Cry9C, або вегетативні інсектицидні білки (Vip), наприклад, Vip1, Vip2, Vip3 або Vip3A; або інсектицидні білки бактерій, які колонізують нематод, наприклад, *Photorhabdus* spp. або *Xenorhabdus* spp., таких як *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсини, які продукуються тваринами, такі як токсини скорпіонів, токсини павукоподібних, токсини ос та інші специфічні для комах нейротоксини; токсини, які продукуються грибами, такі як токсини *Streptomyces*, рослинні лектини, такі як лектини гороху, лектини ячменю або лектини підсніжника; аглютиніни; інгібітори протеїнази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинової протеази, інгібітори пататину, цистатину, папаїну; білки, що інактивують рибосому (RIP), такі як рицин, RIP маїсу, абрин, люфін, сапорин або бріюдин; ферменти метаболізму стероїдів, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-UDP-глікозилтрансфераза, холестериноксидази, інгібітори екдизону, HMG-COA-редуктаза, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих або кальцієвих каналів, естераза ювенільного гормону, рецептори діуретичних гормонів, стильбенсинтаза, дибензилсинтаза, хітинази і глюканази.

У контексті даного винаходу під δ -ендотоксинами, наприклад Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 або Cry9C, або вегетативними інсектицидними білками (Vip), наприклад Vip1, Vip2, Vip3 або Vip3A, безперечно, слід розуміти також гібридні токсини, усичені токсини та модифіковані токсини. Гібридні токсини одержують рекомбінантним способом за допомогою нової комбінації різних доменів тих білків (див., наприклад, WO 02/15701). Відомі усичені токсини, наприклад усичений Cry1Ab. У випадку модифікованих токсинів одна або декілька амінокислот токсину, що зустрічається в природі, є заміщеними. У разі таких амінокислотних замін у токсин переважно вводять послідовності, що не зустрічаються в природному токсині, які розпізнаються протеазами, так, наприклад, у випадку Cry3A055 у токсин Cry3A вводять послідовність, що розпізнається катепсином G (див. WO 03/018810).

Приклади таких токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 і WO 03/052073. Способи одержання таких трансгенних рослин загалом відомі фахівцю у даній галузі та описані, наприклад, у публікаціях, що згадуються вище. Дезоксирибонуклеїнові кислоти CryI-типу та їх одержання відомі, наприклад, із WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 і WO 90/13651.

Токсин, що міститься у трансгенних рослинах, надає рослинам толерантності щодо шкідливих комах. Такі комахи можуть належати до будь-якої таксономічної групи комах, але особливо часто зустрічаються серед жуків (Coleoptera), двокрилих комах (Diptera) та метеликів (Lepidoptera).

Відомі трансгенні рослини, що містять один або декілька генів, які кодують стійкість до інсектицидів, та експресують один або декілька токсинів, і деякі з них є комерційно доступними. Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry3Bb1); YieldGard Plus® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Ab і Cry3Bb1); Starlink® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry9C); Herculex I® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Fa2 і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) із досягненням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac); Bollgard I® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac); Bollgard II® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac і Cry2Ab); VipCot® (сорт бавовнику, що експресує токсин Vip3A і Cry1Ab); NewLeaf® (сорт картоплі, що експресує токсин Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (GA21 з ознакою толерантності до гліфосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 з ознакою стійкості до кукурудзяного метелика (CB)) і Protecta®.

Додатковими прикладами таких трансгенних сільськогосподарських культур є наступні.

1. Маїс Bt11 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікований Zea mays, якому надали стійкості до ураження кукурудзяним метеликом (*Ostrinia nubilalis* та *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенної експресії усиченого токсину Cry1Ab. Маїс Bt11 також трансгенно експресує PAT-фермент із забезпеченням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

2. Маїс Bt176 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікований Zea mays, якому надали стійкості до ураження кукурудзяним метеликом (*Ostrinia nubilalis* та *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенної експресії токсину Cry1Ab. Маїс Bt176 також трансгенно експресує PAT-фермент із досягненням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

3. Маїс MIR604 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Маїс, якому надали стійкості до комах шляхом трансгенної експресії модифікованого токсину Cry3A. Даний токсин являє собою Cry3A055, модифікований шляхом введення послідовності, що розпізнається протеазою катепсином G. Одержання таких трансгенних рослин маїсу описане у WO 03/018810.

4. Маїс MON 863 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/DE/02/9. MON 863 експресує токсин Cry3Bb1 і має стійкість до деяких комах із ряду Coleoptera.

5. Бавовник IPC 531 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/ES/96/02.

6. Маїс 1507 від Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/NL/00/10. Генетично модифікований маїс для експресії білка Cry1F із забезпеченням стійкості до деяких комах із ряду Lepidoptera та білка PAT із забезпеченням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

7. Маїс NK603 × MON 810 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/GB/02/M3/03. Складається із сортів гібридного маїсу, традиційно виведених шляхом схрещування генетично модифікованих сортів NK603 та MON 810. Маїс NK603 × MON 810 трансгенно експресує білок CP4 EPSPS, одержаний зі штаму CP4 *Agrobacterium* sp., який надає толерантності до гербіциду Roundup® (містить гліфосат), а також токсин Cry1Ab, одержаний із *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, який забезпечує толерантність до деяких представників із ряду Lepidoptera, зокрема до кукурудзяного метелика.

Крім того, на сьогоднішній день не спостерігалось перехресної резистентності між сполуками формули (I) (включаючи будь-яку зі сполук, описаних в таблиці 2 (нижче)) і будь-якими фунгіцидними розчинами, що використовуються для забезпечення контролю фітопатогенних грибів в тому числі *Absidia corymbifera*, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp. в тому числі *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium* spp. в тому числі *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp. в тому числі *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp. в тому числі *B. cinerea*, *Candida* spp. в тому числі *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitaniae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephalosporium fragrans*, *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp. в тому числі *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp. в тому числі *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe*

- spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp. в тому числі *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp. в тому числі *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*, *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium musarum*,
 5 *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Helminthosporium* spp, *Hemileia* spp, *Histoplasma* spp. в тому числі *H. capsulatum*, *Laetisaria fuciformis*, *Leptographium lindbergi*, *Leveillula taurica*, *Lophodermium seditiosum*, *Microdochium nivale*, *Microsporium* spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp, *Mycosphaerella* spp. в тому числі *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium theobromaeon*, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp, *Penicillium* spp. в
 10 тому числі *P. digitatum*, *P. italicum*, *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp. в тому числі *P. maydis*, *P. philippinensis* и *P. sorghi*, *Peronospora* spp, *Phaeosphaeria nodorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus igniarius*, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*, *Phytophthora* spp. в тому числі *P. infestans*, *Plasmopara* spp. в тому числі *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp. в тому числі *P. leucotricha*, *Polymyxa graminis*, *Polymyxa betae*,
 15 *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp. в тому числі *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* Spp. в тому числі *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. tritici*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp. в тому числі *P. oryzae*, *Pythium* spp. в тому числі *P. ultimum*, *Ramularia* spp, *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. в тому числі *S. apiospermum* и *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*, *Sclerotinia* spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, в тому числі *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp., в тому числі *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Ucinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. в тому числі *V. inaequalis*, *Verticillium* spp, и *Xanthomonas* spp., in particular, *Zymoseptoria tritici*, *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Erysiphe graminis*, *Ucinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Leveillula taurica*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Pyricularia oryzae*, *Alternaria solani*, *Alternaria alternata*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Colletotrichum lagenarium*, *Didymella bryoniae*, *Ascochyta pisii*, *Verticillium dahliae*, *Pyrenophora teres*, *Cercospora beticola*, *Ramularia collo-cygni*,
 30 *Botrytis cinerea*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Monilinia laxa*, *Monographaella nivalis* и *Venturia inaequalis*.
 Дійсно, в науковій літературі повідомлялось про стійкі до фунгіцидів штами у будь-якого з видів, що перераховані вище, при цьому штами стійкі до одного або декількох фунгіцидів із щонайменше одного з наступних класів фунгіцидів за механізмом дії: інгібітори зовнішнього хінон-зв'язуючого сайту (QoI), інгібітори внутрішнього хінон-зв'язуючого сайту (QiI), інгібітори сукцинатдегідрогенази (SDHI) і інгібітори деметилювання стеринів (DMI). Такі стійкі до фунгіцидів штами можуть містити наступне.
 35 - Мутація в мітохондріальному гені цитохрому b, що надає стійкість до інгібіторів Qo, де мутація являє собою G143A, F129L або G137R. Див., наприклад: Gisi et al., *Pest Manag Sci* 56, 833-841 (2000), Lucas, *Pestic Outlook* 14(6), 268-70 (2003), Fraaije et al., *Phytopathol* 95(8), 933-41 (2005), Sierotzki et al., *Pest Manag Sci* 63(3), 225-233 (2007), Semar et al., *Journal of Plant Diseases and Protection* (3), 117-119 (2007); і Pasche et al., *Crop Protection* 27(3-5), 427-435 (2008).
 40 - Мутація в мітохондріальному гені цитохрому b, що надає стійкість до інгібіторів Qi, де мутація являє собою G37A/C/D/S/V. Див., наприклад: Meunier et al., *Pest Manag Sci* 2019; 75: 2107-2114.
 45 - Мутація в генах, що кодують субодиниці SdhB, C, D, що надає стійкість до інгібіторів SDHI, при цьому мутація наявна в наступних основних патогенах:
Botrytis cinerea: B-P225H/L/T/Y/F, B-N230I, B-H272L/Y/R, C-P80H/L, C-N87S;
Alternaria solani: B-H278R/Y, C-H134R/Q, D-D123E, D-H133R і C-H134R;
Zymoseptoria tritici: sdhB: N225T, N225I, R265P, T268I, T268A. В sdhC: T79N, T79I, W80S, W80A, A84F, N86S, N86A, P127A, R151M/S/T/G, R151S, R151T, H152R/Y, V166M, T168R. В sdhD: I50F, M114V, D129G, T20P+K186R;
 50 *Pyrenophora teres*: В sdhB: S66P, N235I, H277Y. В sdhC: K49E, R64K, N75S, G79R, H134R, S135R. В sdhD: D124E, H134R, G138V, D145G;
Ramularia collo-cygni: В sdhB: N224T, T267I. В sdhC: N87S, G91R, H146R/L, G171D, H153R;
 55 *Phakopsora pachyrhizi*: C-I86F;
Sclerotinia sclerotiorum: В sdhB: H273Y. В sdhC: G91R, H146R. В sdhD: T108K, H132R, G150R.
 Основним джерелом інформації є www.frac.info, Sierotzki and Scalliet *Phytopathology* (2013) 103(9): 880–887 і Simões et al., *J Plant Dis Prot* (2018) 125: 21-2.
 60 - Мутація або комбінація мутацій в гені CYP51, що надає стійкість до інгібіторів DMI, де мутації являють собою: L50S, D134G, V136A/C, Y137F, S188N, A379G, I381V, делецію 459-460,

Y461H/S, N513K, S524T. Основним джерелом інформації є www.frac.info, Cools et al., Plant Pathol (2013) 62: 36-42 і Schmitz HK et al., Pest Manag Sci (2014) 70: 378-388.

Таким чином, в переважному варіанті здійснення сполуки формули (I) (в тому числі будь-яку зі сполук, описаних в таблиці 2 (нижче)), або фунгіцидні композиції згідно з даним винаходом, що містять сполуку формули (I), використовують для контролю штамів грибів, які є стійкими до одного або кількох фунгіцидів будь-якого з наступних класів фунгіцидів: інгібітори зовнішнього хінон-зв'язуючого сайту (QoI), інгібітори внутрішнього хінон-зв'язуючого сайту (Qil), інгібітори сукцинатдегідрогенази (SDHI) та інгібітори деметилювання стеринів (DMI).

Застосовуваний у даному документі термін "місце зростання" означає поля, на яких або в яких вирощують рослини, або на яких висівають насіння культивованих рослин, або де насінину будуть поміщати в ґрунт. Він включає ґрунт, насіння та саджанці, а також наявні зелені рослини.

Термін "рослини" означає всі фізичні частини рослини, включаючи насіння, саджанці, пагони, корені, бульби, стебла, квітконіжки, листя та плоди.

Термін "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти як такий, що означає генеративні частини рослини, такі як насіння, що можна застосовувати для розмноження останньої, і вегетативний матеріал, такий як паростки або бульби, наприклад картопляні. Можуть бути згадані, наприклад, насіння (у більш точному розумінні), коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища та частини рослин. Також можуть бути згадані пророслі рослини та молоді рослини, які треба пересадити після проростання або після появи сходів із ґрунту. Ці молоді рослини можна захистити до пересадки повною або частковою обробкою шляхом занурення. Переважно "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти як такий, що означає насіння.

Пестицидні засоби, наведені в цьому документі з використанням їхньої загальноприйнятої назви, відомі, наприклад, із "The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009.

Сполуки формули (I) можна застосовувати в немодифікованій формі або переважно разом із допоміжними речовинами, які традиційно застосовують у галузі складання. Для цього їх можна зручно складати відомим способом в здатні до емульгування концентрати, пасти, які наносять у вигляді покриття, розчини або суспензії, які безпосередньо розпилюють або розводять, розведені емульсії, змочувані порошки, розчинні порошки, пилоподібні препарати, грануляти, а також інкапсульзовані форми, наприклад, у полімерних речовинах. Як і у випадку з типом композицій, способи застосування, такі як розпилення, дрібнодисперсне розпилення, обпилення, розсіювання, нанесення покриття або полив, вибирають згідно з передбаченими цілями та переважними умовами. Композиції також можуть містити додаткові допоміжні речовини, такі як стабілізатори, піногасники, регулятори в'язкості, зв'язувальні речовини або речовини для підвищення клейкості, а також добрива, донори мікроелементів або інші складові для одержання особливих ефектів.

Придатні носії і допоміжні речовини, наприклад, для застосування у сільському господарстві можуть бути твердими або рідкими та являти собою речовини, застосовні у технології складання, наприклад природні або регенеровані мінеральні речовини, розчинники, диспергувальні речовини, змочувальні засоби, речовини для підвищення клейкості, загусники, зв'язувальні речовини або добрива. Такі носії, наприклад, описані у WO 97/33890.

Сполуки формули (I) зазвичай застосовують у формі композицій, та їх можна застосовувати щодо посівної площі або рослини, що підлягає обробці, одночасно або послідовно з додатковими сполуками. Такі додаткові сполуки можуть являти собою, наприклад, добрива, або донори мікроелементів, або інші препарати, які впливають на ріст рослин. Вони також можуть являти собою селективні гербіциди або неселективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематоциди, молюскоциди або суміші декількох із таких препаратів, якщо це необхідно, разом із додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами або допоміжними речовинами, що полегшують застосування, зазвичай застосовуваними в галузі складання.

Сполуки формули (I) можна застосовувати у формі (фунгіцидних) композицій для контролю або захисту від фітопатогенних мікроорганізмів, що містять як активний інгредієнт щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, як визначено вище, у вільній формі або у формі агрохімічно застосовної солі та щонайменше одну з наведених вище допоміжних речовин.

У даному винаході передбачена композиція, переважно фунгіцидна композиція, що містить щонайменше одну сполуку формули (I), прийнятний для сільського господарства носій і необов'язково допоміжну речовину. Прийнятний для сільського господарства носій являє собою, наприклад, носій, який є придатним для застосування у сільському господарстві. Носії для сільського господарства добре відомі з рівня техніки. Переважно вказана композиція може містити щонайменше одну або декілька пестицидно активних сполук, наприклад додатковий фунгіцидно активний інгредієнт додатково до сполуки формули (I).

Сполука формули (I) може бути єдиним активним інгредієнтом у композиції, або вона може бути змішана з одним або декількома додатковими активними інгредієнтами, такими як пестицид, фунгіцид, синергіст, гербіцид або регулятор росту рослин, якщо це необхідно. Додатковий активний інгредієнт може у деяких випадках зумовлювати появу неочікуваних синергічних активностей.

Приклади придатних додаткових активних інгредієнтів включають наступні: фунгіциди групи ациклоамінокислоти, фунгіциди групи аліфатичних азотовмісних сполук, фунгіциди групи амідів, фунгіциди групи анілідів, фунгіциди групи антибіотиків, фунгіциди групи ароматичних сполук, миш'яковмісні фунгіциди, фунгіциди групи арилфенілкетонів, фунгіциди групи бензамідів, фунгіциди групи бензанілідів, фунгіциди групи бензімідазолів, фунгіциди групи бензотіазолів, рослинні фунгіциди, фунгіциди групи місткових дифенілів, фунгіциди групи карбаматів, фунгіциди групи карбанілатів, фунгіциди групи коназолів, фунгіциди, що містять мідь, фунгіциди групи дикарбоксимідів, фунгіциди групи динітрофенолів, фунгіциди групи дитіокарбаматів, фунгіциди групи дитіоланів, фунгіциди групи фурамідів, фунгіциди групи фуранілідів, фунгіциди групи гідразидів, фунгіциди групи імідазолів, фунгіциди, що містять ртуть, фунгіциди групи морфолінів, фунгіциди групи фосфорорганічних сполук, фунгіциди групи оловоорганічних сполук, фунгіциди групи оксатіїнів, фунгіциди групи оксазолів, фунгіциди групи фенілсульфамідів, фунгіциди групи полісульфідів, фунгіциди групи піразолів, фунгіциди групи піридинів, фунгіциди групи піримідинів, фунгіциди групи піролів, фунгіциди групи четвертинних амонієвих сполук, фунгіциди групи хінолінів, фунгіциди групи хінонів, фунгіциди групи хіноксалінів, фунгіциди групи стробілуринів, фунгіциди групи сульфонанілідів, фунгіциди групи тіадіазолів, фунгіциди групи тіазолів, фунгіциди групи тіазолідинів, фунгіциди групи тіокарбаматів, фунгіциди групи тіофенів, фунгіциди групи триазинів, фунгіциди групи триазолів, фунгіциди групи триазолопіримідинів, фунгіциди групи сечовини, фунгіциди групи валінамідів та фунгіциди, що містять цинк.

Приклади відповідних додаткових активних інгредієнтів також включають наступні: нафтові масла, 1,1-біс(4-хлорфеніл)-2-етоксиетанол, 2,4-дихлорфеніл бензолсульфонат, 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамід, 4-хлорфеніл-феніл-сульфон, ацетопрол, альдоксикарб, амідітін, амідотіоат, амітон, амітону гідрооксалат, амітраз, араміт, оксид миш'яку, азобензол, азотоат, беноміл, беноксафос, бензилбензоат, біксафен, брофенвалерат, бромациклен, бромифос, бромпропілат, бупрофезин, бутоксикарбоксим, бутоксикарбоксим, бутилпіридабен, полісульфід кальцію, камфехлор, карбанолат, карбофенотіон, циміазол, хінометіонат, хлорбензид, хлордимеформ, гідрохлорид хлордимеформу, хлорфенетол, хлорфенсон, хлорфенсульфід, хлоробензилат, хлоромебуформ, хлорометиурон, хлорпропілат, хлортіофос, цинерин I, цинерин II, цинерини, клозантел, кумафос, кротамітон, кротоксифос, куфранеб, ціантоат, DCPM, DDT, демефін, демефін-О, демефін-S, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, дихлорфлуанід, дихлофос, дикліфос, діенохлор, димефокс, динекс, динекс-дихлексин, динокап-4, динокап-6, диноктон, динолентон, диноссульфон, динотербон, диоксатіон, дифенілсульфон, дисульфірам, DNOC, дофенапін, дорамектин, ендотіон, еприномектин, етоат-метил, етримфос, феназафлор, оксид фенбутатину, фенотіокарб, фенпірад, фенпіроксимат, фенпіразамін, фензон, фентрифеніл, флубензімін, флуциклоксурон, флуенетил, флуорбензид, FMC 1137, форметанат, гідрохлорид форметанату, формпаранат, гамма-HCH, гліудин, галфенпрокс, гексадецилциклопропанкарбоксилат, ізокарбофос, жасмолін I, жасмолін II, йодофенфос, ліндан, малонбен, мекарбам, мефосфолан, месульфен, метакрифос, метилбромід, метолкарб, мексакарбат, оксим мілбеміцину, міпафокс, монокротофос, морфотіон, моксидактин, налед, 4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридил)метокси]піридазин-3-он, ніфлуридид, ніккоміцини, нітрилакарб, комплекс нітрилакарбу і хлориду цинку 1:1, ометоат, оксидефос, оксидисульфотон, pp'-DDT, паратіон, перметрин, фенкаптон, фозалон, фосфолан, фосфамідон, поліхлортерпени, полінактини, проклонол, промацил, пропоксур, протидатіон, протоат, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридафентіон, піримітат, хіналфос, квінтіофос, R-1492, фосгліцин, ротенон, шрадан, себуфос, селамектин, софамід, SSI-121, сульфірам, сульфлурамід, сульфотеп, сірка, дифловідазин, тау-флювалінат, TEPP, тербам, тетрадифон, тетрасул, тіафенокс, тіокарбоксим, тіофанокс, тіометон, тіоквінокс, турингієнсин, триаміфос, триаратен, триазофос, триазурон, трифенофос, трінактин, вамідотіон, ваніліпрол, бетоксазин, диоктаноат міді, сульфат міді, цибутрин, дихлон, дихлорофен, ендотал, фентин, гашене вапно, набам, квінокламін, квінонамід, симазин, ацетат трифенілтину, гідроксид трифенілтину, круфомат, піперазин, тіофанат, хлоралозу, фентіон, піридин-4-амін, стрихнін, 1-гідрокси-1H-піридин-2-тіон, 4-(хіноксалін-2-іламіно)бензолсульфонамід, 8-гідроксигіноліносульфат, бронопол, гідроксид міді, крезол, дипіритіон, додицин, фенаміносульф, формальдегід, гідраргафен, касугаміцин, гідрат гідрохлориду касугаміцину,

біс(диметилдитіокарбамат) нікелю, нітрапірин, октилінон, оксолінову кислоту, окситетрациклін, гідроксигінолінсульфат калію, пробеназол, стрептоміцин, сесквисульфат стрептоміцину, теклофталам, тіомерсал, *Adoxophyes orana* GV, *Agrobacterium radiobacter*, *Amblyseius* spp., *Anagrapha falcifera* NPV, *Anagrus atomus*, *Aphelinus abdominalis*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes* aphidimyza, *Autographa californica* NPV, *Bacillus sphaericus* Neide, *Beauveria brongniartii*, *Chrysoperla carnea*, *Cryptolaemus montrouzieri*, *Cydia pomonella* GV, *Dacnusa sibirica*, *Diglyphus isaea*, *Encarsia formosa*, *Eretmocerus eremicus*, *Heterorhabditis bacteriophora* і *H. megidis*, *Hippodamia convergens*, *Leptomastix dactylopii*, *Macrolophus caliginosus*, *Mamestra brassicae* NPV, *Metaphycus helvolus*, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum*, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, *Neodiprion sertifer* NPV і *N. lecontei* NPV, *Orius* spp., *Paecilomyces fumosoroseus*, *Phytoseiulus persimilis*, *Steinernema bibionis*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema feltiae*, *Steinernema glaseri*, *Steinernema riobrave*, *Steinernema riobrave*, *Steinernema scapterisci*, *Steinernema* spp., *Trichogramma* spp., *Typhlodromus occidentalis*, *Verticillium lecanii*, афолат, бісазир, бусульфам, диматиф, хемел, хемпу, метепу, метіотепу, метилафолат, морзид, пенфлурон, тепу, тіохемпу, тіотепу, третамін, уредепу, (Е)-дец-5-ен-1-іацетат із (Е)-дец-5-ен-1-олом, (Е)-тридец-4-ен-1-іацетат, (Е)-6-метилгепт-2-ен-4-ол, (Е, Z)-тетрадека-4,10-дієн-1-іацетат, (Z)-додец-7-ен-1-іацетат, (Z)-гексадец-11-еналь, (Z)-гексадец-11-ен-1-іацетат, (Z)-гексадец-13-ен-11-ін-1-іацетат, (Z)-ейкоз-13-ен-10-он, (Z)-тетрадец-7-ен-1-аль, (Z)-тетрадец-9-ен-1-ол, (Z)-тетрадец-9-ен-1-іацетат, (7Е, 9Z)-додека-7,9-дієн-1-іацетат, (9Z, 11Е)-тетрадека-9,11-дієн-1-іацетат, (9Z, 12Е)-тетрадека-9,12-дієн-1-іацетат, 14-метилоктадец-1-ен, 4-метилнонан-5-ол із 4-метилнонан-5-оном, альфа-мультистріатин, бревікомін, кодлелур, кодлемон, куелур, диспарлур, додец-8-ен-1-іацетат, додец-9-ен-1-іацетат, додека-8,10-дієн-1-іацетат, домінікалур, етил-4-метилоктаноат, євгенол, фронталін, грандлур, грандлур I, грандлур II, грандлур III, грандлур IV, гексалур, іпсдієнол, іпсенол, японілур, лінеатин, літлур, луплур, медлур, мегатомову кислоту, метилєвгенол, мускалур, октадека-2,13-дієн-1-іацетат, октадека-3,13-дієн-1-іацетат, орфралур, орикталур, острамон, сиглур, сордідин, сулкатол, тетрадец-11-ен-1-іацетат, тримедлур, тримедлур А, тримедлур В1, тримедлур В2, тримедлур С, транк-кол, 2-(октилтіо)етанол, бутопіроноксил, бутокси(поліпропіленгліколь), дибутіладипат, дибутілфталат, дибутілсукцинат, діетилтолуамід, диметилкарбат, диметилфталат, етилгександіол, гексамід, метоквін-бутил, метилнеодеканамід, оксамат, пікаридин, 1-дихлор-1-нітроетан, 1,1-дихлор-2,2-біс(4-етилфеніл)етан, 1,2-дихлорпропан із 1,3-дихлорпропеном, 1-бром-2-хлоретан, 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфеніл)етилацетат, 2,2-дихлорвініл-2-етилсульфінетилметилфосфат, 2-(1,3-дитіолан-2-іл)фенілдиметилкарбамат, 2-(2-бутоксиетокси)етилтіоціанат, 2-(4,5-диметил-1,3-диоксолан-2-іл)фенілметилкарбамат, 2-(4-хлор-3,5-ксілілокси)етанол, 2-хлорвінілдіетилфосфат, 2-імідазолідон, 2-ізовалериліндан-1,3-діон, 2-метил(проп-2-ініл)амінофенілметилкарбамат, 2-тіоціанатоетиллаурат, 3-бром-1-хлорпроп-1-ен, 3-метил-1-фенілпіразол-5-ілдиметилкарбамат, 4-метил(проп-2-ініл)аміно-3,5-ксілілметилкарбамат, 5,5-диметил-3-оксоциклогекс-1-енілдиметилкарбамат, ацетіон, акрилонітрил, альдрин, аллозамідин, аліксікарб, альфа-екдизон, фосфід алюмінію, амінокарб, анабазин, атидатіон, азаметифос, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, гексафторсилікат барію, полісульфід барію, бартрин, Bayer 22/190, Bayer 22408, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, біоетанометрин, біоперметрин, біс(2-хлоретил)етер, буру, бромфенвінфос, бром-DDT, буфенкарб, бутакарб, бутатіофос, бутонат, арсенат кальцію, ціанід кальцію, сірковуглець, тетрахлорметан, гідрохлорид картапу, цевадин, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, цис-ресметрин, цисметрин, клоцитрин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, олеат міді, кумітоат, кріоліт, CS 708, ціанофенфос, ціанофос, циклетрин, цитіоат, d-тетраметрин, DAEP, дазомет, декарбофуран, діамідафос, дикаптон, дихлофентіон, дикрезил, дицикланіл, діелдрин, діетил-5-метилпіразол-3-ілфосфат, дилор, димефлутрин, диметан, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динопроп, диносам, диносеб, діофенолан, діоксабензофос, дитикрофос, DSP, екдистерон, EI 1642, EMPC, EPBP, етафос, етіофенкарб, етилформіат, етилендибромід, етилендихлорид, етиленоксид, EXD, фенхлофос, фенетакарб, фенітротіон, феноксакрим, фенпіритрин, фенсульфотіон, фентіон-етил, флукофулон, фосметилан, фоспірат, фостіетан, фураціокарб, фуретрин, гуазатин, ацетати гуазатину, тетраціокарбонат натрію, галфенпрокс, HCH, HEOD, гептахлор, гетерофос, HHDN, синільну кислоту, хіквінкарб, IPSP, ізазофос, ізобензан, ізодрин, ізофенфос, ізолан, ізопротіолан, ізоксатіон, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III, келеван, кінопрен, арсенат свинцю, лептофос, ліримфос, літідатіон, метилкарбамат м-куменілу, фосфід магнію, мазидокс, мекарфон, меназон, хлорид ртуті, месульфенфос, метам, метам-калій, метам-натрій, метансульфонілфторид, метокротофос, метопрен, метотрин, метоксихлор, метилізотіоціанат, метилхлороформ, метиленхлорид, метоксadiaзон, мірекс, нафталофос, нафталін, NC-170,

нікотин, сульфат нікотину, нітіазин, норнікотин, О-5-дихлор-4-йодфеніл-О-етилетилфосфонотіоат, О, О-діетил-О-4-метил-2-оксо-2Н-хромен-7-ілфосфоротіоат, О, О-діетил-О-6-метил-2-пропілпіримідин-4-ілфосфоротіоат, О, О, О',О'-тетрапропілдитіопірофосфат, олеїнову кислоту, пара-дихлорбензол, паратіон-метил, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат, РН 60-38, фенкаптон, фосніхлор, фосфін, фоксим-метил, піриметафос, ізомери поліхлордициклопентадієну, арсеніт калію, тіоціанат калію, прекоцен І, прекоцен ІІ, прекоцен ІІІ, примідофос, профлутрин, промекарб, протіофос, піразофос, піресметрин, квасію, хіналфос-метил, квінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, кадетрин, ріанію, ріанодин, сабадилу), шрадан, себуфос, SI-0009, тіапроніл, арсеніт натрію, ціанід натрію, фторид натрію, гексафторсилікат натрію, пентахлорфеноксид натрію, селенат натрію, тіоціанат натрію, сулькофурон, сулькофурон-натрій, сульфурилфторид, сульпрофос, дьогтьові масла, тазимкарб, TDE, тебупіримфос, темефос, тералетрин, тетрахлоретан, тикрофос, тіоциклам, гідрогеноксалат тіоцикламу, тіоназин, тіосултап, тіосултап-натрій, тралометрин, трансперметрин, тріазамат, трихлорметафос-3, трихлоронат, триметакарб, толпрокарб, трихлорпікарб, трипрен, вератридин, вератрин, ХМС, зетаметрин, фосфід цинку, золапрофос і меперфлутрин, тетраметилфлутрин, біс(трибутилтин)оксид, бромацетамід, фосфат тривалентного заліза, нікосамід-оламін, оксид трибутилтину, піриморф, трифенморф, 1,2-дибром-3-хлорпропан, 1,3-дихлорпропен, 3,4-дихлортетрагідротіофен 1,1-діоксид, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 5-метил-6-тіоксо-1,3,5-тіадіазинан-3-ілоцтову кислоту, 6-ізопентеніламінопурин, бенклотіаз, цитокініни, DCIP, фурфурол, ізамідофос, кінетин, композицію на основі *Myrothecium verrucaria*, тетрахлортіофен, ксиленоли, зеатин, етилксантат калію, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, екстракт *Reynoutria sachalinensis*, альфа-хлоргідрин, анту, карбонат барію, бістіосемі, бродифакум, бромадіолон, брометалін, хлорофацинон, холекальциферол, кумахлор, кумафурил, куматетраліл, кримідин, дифенакум, дифетіалон, дифацинон, ергокальциферол, флокумафен, флуороацетамід, флупропадин, гідрохлорид флупропадину, норбормід, фосацетим, фосфор, піндон, піринурон, скілірозид, фторацетат натрію, сульфат талію, варфарин, 2-(2-бутоксietокси)етилпіперонілат, 5-(1,3-бензодіоксол-5-іл)-3-гексилциклогекс-2-енон, фарнезол із неролідолом, вербутин, MGK 264, піперонілбутоксид, піпротал, ізомер пропілу, S421, сезамекс, сезасмолін, сульфоксид, антрахінон, нафтенат міді, оксихлорид міді, дициклопентадієн, тирам, нафтенат цинку, цирам, іманін, рибавірин, оксид ртуті, тіофанат-метил, азаконазол, бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диніконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флуквінконазол, флузилазол, флутріафол, фураметпір, гексаконазол, імазаліл, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, протіоконазол, пірифенокс, прохлораз, пропіконазол, пірзоксазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, тріадимефон, тріадименол, трифлумізол, тритиконазол, анцимідол, фенаримол, нуаримол, бупіримат, диметиримол, етиримол, додеморф, фенпропідин, фенпропіморф, спіроксамін, тридеморф, ципродиніл, мепаніпірім, піриметаніл, фенпіклоніл, флудіоксоніл, беналаксил, фуралаксил, металаксил, R-металаксил, офурас, оксадиксил, карбендазим, дебакарб, фуберидазол, тіабендазол, хлзолінат, дихлзолін, міклозолін, процимідон, вінклозолін, боскалід, карбоксин, фенфурам, флутоланіл, мепроніл, оксикарбоксин, пентіопірад, тифлузамід, додин, іміноктадин, азоксистробін, димоксистробін, енестробурин, фенамінстробін, флуфеноксистробін, флуоксастробін, крезоксим-метил, метоміностробін, трифлуксистробін, оризастробін, пікоксистробін, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, фербам, манкозеб, манеб, метирам, пропінеб, цинеб, каптафол, каптан, фтороїмід, фолпет, толілфлуанід, бордоську суміш, оксид міді, манкопер, оксинову мідь, нітротал-ізопропіл, едифенфос, іпробенфос, фосдифен, толклофос-метил, анілазин, бентіавалікарб, бластицидин-S, хлоронеб, хлороталоніл, цифлуфенамід, цимоксаніл, циклобутрифлурам, диклоцимет, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, диметоморф, флуморф, дитіанон, етабоксам, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, феноксаніл, феримзон, флуазином, флуметилсульфорим, флуопіколід, флуокситіоконазол, флусульфамід, флуксапіроксад, фенгексамід, фосетил-алюміній, хімексазол, іпровалікарб, ціазофамід, метасульфоккарб, метрафенон, пенцикурон, фталід, поліоксини, пропамокарб, пірибенкарб, проквіназид, піроквілон, піріофенон, квіноксифен, квінтозен, тіадиніл, тріазоксид, трициклазол, трифорин, валідаміцин, валіфеналат, зоксамід, мандипропамід, флubenетерам, ізопіразам, седаксан, бензовіндіфлупір, підіфлуметофен, 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонова кислота (3',4',5'-трифтор-біфеніл-2-іл)-амід, ізофлуципрам, ізотіаніл, дипіметитрон, 6-етил-5,7-діоксо-піроло[4,5][1,4]дитііно[1,2-с]ізотіазол-3-карбонітрил, 2-(дифторметил)-N-[3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл]піридин-3-карбоксамід, 4-(2,6-дифторфеніл)-6-метил-5-феніл-піридазин-3-карбонітрил, (R)-3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметиліндан-4-іл]піразол-4-карбоксамід, 4-(2-бром-4-фтор-феніл)-N-(2-хлор-6-фтор-феніл)-2,5-диметил-піразол-3-амін, 4-(2-бром-4-

фторфеніл)-N-(2-хлор-6-фторфеніл)-1,3-диметил-1H-піразол-5-амін, флуіндапір, куметоксистробін (цзясянцзюньчжи), льюйбэньмисяньань, дихлобентиазокс, мандестробін, 3-(4,4-дифтор-3,4-дигідро-3,3-диметилізохінолін-1-іл)хінолон, 2-[2-фтор-6-[(8-фтор-2-метил-3-хіноліл)окси]феніл]пропан-2-ол, оксатіапіпролін, трет-бутил-N-[6-[[[(1-метилтетразол-5-іл)-феніл-метилен]аміно]оксиметил]-2-піридил]карбамат, піразифлумід, інпірфлуксам, тролпрокарб, мефентрифлуконазол, інфентрифлуконазол, 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-етил-1,1-диметиліндан-4-іл]піридин-3-карбоксамід, N'-(2,5-диметил-4-фенокси-феніл)-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[4-(4,5-дихлортіазол-2-іл)окси-2,5-диметил-феніл]-N-етил-N-метил-формамідин, [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-біс(дифторметил)піразол-1-іл]ацетил]-4-піперидил]тіазол-4-іл]-4,5-дигідрозоксазол-5-іл]-3-хлор-феніл] метансульфонат, бут-3-ініл-N-[6-[[[(Z)-[(1-метилтетразол-5-іл)-феніл-метилен]аміно]оксиметил]-2-піридил]карбамат, метил-N-[[5-[4-(2,4-диметилфеніл)тріазол-2-іл]-2-метил-феніл]метил]карбамат, 3-хлор-6-метил-5-феніл-4-(2,4,6-трифторфеніл)піридазин, піридахлометил, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметиліндан-4-іл]піразол-4-карбоксамід, 1-[2-[[1-(4-хлорфеніл)піразол-3-іл]оксиметил]-3-метилфеніл]-4-метилтетразол-5-он, 1-метил-4-[3-метил-2-[[2-метил-4-(3,4,5-триметилпіразол-1-іл)фенокси]метил]феніл]тетразол-5-он, амінопірифен, аметоктрадин, амісулбром, пенфлуфен, (Z, 2E)-5-[1-(4-хлорфеніл)піразол-3-іл]окси-2-метоксиіміно-N, 3-диметил-пент-3-енамід, флорилпікоксамід, фенпікоксамід, метарилпікоксамід, тебуфлоквін, інфлуфеноквін, квінофумелін, ізофетамід, N-[2-[2,4-дихлор-фенокси]феніл]-3-(дифторметил)-1-метил-піразол-4-карбоксамід, N-[2-[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]феніл]-3-(дифторметил)-1-метил-піразол-4-карбоксамід, бензотіостробін, фенамакрил, цинкову сіль 5-аміно-1,3,4-тіадіазол-2-тіолу (2:1), флуопірам, флуфеноксadiaзам, флутіаніл, флуопімомід, пірапропон, пікарбутразокс, 2-(дифторметил)-N-(3-етил-1,1-диметиліндан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1, 1, 3-триметиліндан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, метилтетрапрол, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1, 1, 3-триметиліндан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, α-(1, 1-диметилетил)-α-[4'-(трифторметокси)[1, 1'-біфеніл]-4-іл]-5-піримідинметанол, флуоксапіпролін, еноксастробін, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(5-сульфаніл-1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(5-тіоксо-4Н-1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, тринексапак, кумоксистробін, чжуншенміцин, тіодіазол міді, тіазол цинку, амектотрактин, іпродіон, себоктиламін, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1S)-1-метил-2-пропокси-етокси]-3-піридил]-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1R)-1-метил-2-пропокси-етокси]-3-піридил]-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-етокси)-3-піридил]-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[5-хлор-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-етокси)-3-піридил]-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-етокси)-3-піридил]-N-ізопропіл-N-метил-формамідин (ці сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2015/155075); N'-[5-бром-2-метил-6-(2-пропоксипропокси)-3-піридил]-N-етил-N-метил-формамідин (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в IPCOM000249876D); N-ізопропіл-N'-[5-метокси-2-метил-4-(2,2,2-трифтор-1-гідрокси-1-феніл-етил)феніл]-N-метил-формамідин, N'-[4-(1-циклопропіл-2,2,2-трифтор-1-гідрокси-етил)-5-метокси-2-метил-феніл]-N-ізопропіл-N-метил-формамідин (ці сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2018/228896); N-етил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)оксетан-2-іл]феніл]-N-метил-формамідин, N-етил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)тетрагідрофуран-2-іл]феніл]-N-метил-формамідин (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2019/110427); N-[(1R)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-еніл]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1S)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-еніл]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1R)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропіл]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1S)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропіл]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-7,8-дифтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-7,8-дифтор-хінолін-3-карбоксамід, 8-фтор-N-[(1R)-1-[(3-фторфеніл)метил]-1,3-диметил-бутил]хінолін-3-карбоксамід, 8-фтор-N-[(1S)-1-[(3-фторфеніл)метил]-1,3-диметил-бутил]хінолін-3-карбоксамід, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-((1R)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-еніл)-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід, N-((1S)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-еніл)-8-фтор-хінолін-3-карбоксамід (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/153380); 1-(6,7-диметилпіразоло[1,5-а]піридин-3-іл)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-ізохінолін, 1-(6,7-диметилпіразоло[1,5-а]піридин-3-іл)-4,4,6-трифтор-3,3-диметил-ізохінолін, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(6-метилпіразоло[1,5-а]піридин-3-іл)ізохінолін, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(7-метилпіразоло[1,5-а]піридин-3-іл)ізохінолін, 1-(6-хлор-7-метил-піразоло[1,5-а]піридин-3-іл)-4,4-

дифтор-3,3-диметил-ізохінолін (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/025510); 1-(4,5-диметилбензімідазол-1-іл)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-ізохінолін, 1-(4,5-диметилбензімідазол-1-іл)-4,4-дифтор-3,3-диметил-ізохінолін, 6-хлор-4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензімідазол-1-іл)ізохінолін, 4,4-дифтор-1-(5-фтор-4-метил-бензімідазол-1-іл)-3,3-диметил-ізохінолін, 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-1-ізохінолін)-7,8-дигідро-6Н-циклопента[е]бензімідазол (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2016/156085); N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]циклопропанкарбоксамід, N, 2-диметокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, N-етил-2-метил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовина, 1,3-диметокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовина, 3-етил-1-метокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовина, N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, 4,4-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]ізоксазолідин-3-он, 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]ізоксазолідин-3-он, етил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]піразол-4-карбоксилат, N, N-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]-1,2,4-тріазол-3-амін (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/055473, WO 2017/055469, WO 2017/093348 або WO 2017/118689); 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-піридил]-1-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропан-2-ол (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/029179); 2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-піридил]-1-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропан-2-ол (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/029179); 3-[2-(1-хлорциклопропіл)-3-(2-фторфеніл)-2-гідрокси-пропіл]імідазол-4-карбонітрил (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2016/156290); 3-[2-(1-хлорциклопропіл)-3-(3-хлор-2-фтор-феніл)-2-гідрокси-пропіл]імідазол-4-карбонітрил (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2016/156290); (4-феноксифеніл)метил-2-аміно-6-метил-піридин-3-карбоксилат (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2014/006945); 2,6-диметил-1Н, 5Н-[1,4]дитііно[2,3-с:5,6-с']дипірол-1,3,5,7(2Н, 6Н)-тетрон (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2011/138281)-N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензолкарботіоамід; N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензамід; (Z, 2E)-5-[1-(2,4-дихлорфеніл)піразол-3-іл]окси-2-метоксиіміно-N, 3-диметил-пент-3-енамід (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2018/153707); N'-(2-хлор-5-метил-4-фенокси-феніл)-N-етил-N-метил-формамідин; N'-(2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метил-феніл)-N-етил-N-метил-формамідин (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2016/202742); 2-(дифторметил)-N-[(3S)-3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл]піридин-3-карбоксамід (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2014/095675); (5-метил-2-піридил)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метанон, (3-метилізоксазол-5-іл)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метанон (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2017/220485); 2-оксо-N-пропіл-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]ацетамід (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2018/065414); етил-1-[[5-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]-2-тієніл]метил]піразол-4-карбоксилат (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних в WO 2018/158365); 2,2-дифтор-N-метил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]ацетамід, N-[(E)-метоксиімінометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензамід, N-[(Z)-метоксиімінометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензамід, N-[N-метокси-С-метил-карбонімідоіл]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензамід (такі сполуки можна одержувати зі способів, описаних в WO 2018/202428).

Сполуки за даним винаходом також можна застосовувати в комбінації з антигельмінтними засобами. Такі антигельмінтні засоби включають сполуки, вибрані зі сполук класу макроциклічних лактонів, таких як похідні івермектину, авермектину, абамектину, емабектину, еприномектину, дорамектину, селамектину, моксидектину, немадектину та мілбеміцину, описані в EP-357460, EP-444964 і EP-594291. Додаткові антигельмінтні засоби включають напівсинтетичні та біосинтетичні похідні авермектину/мілбеміцину, такі як описані в US-5015630, WO-9415944 і WO-9522552. Додаткові антигельмінтні засоби включають бензімідазоли, такі як албендазол, камбендазол, фенбендазол, флубендазол, мебендазол, оксфендазол, оксбендазол, парбендазол та інші члени даного класу. Додаткові антигельмінтні засоби включають імідазотіазоли та тетрагідропіримідини, такі як тетрамізол, левамізол, пірантелу памоат, оксантел або морантел. Додаткові антигельмінтні засоби включають флукіциди, такі як триклабендазол і клорсулон, а також цестоциди, такі як празиквантел й еспипрантел.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з похідними й аналогами антигельмінтних засобів класу парагерксаміду/маркфортину, а також із протипаразитарними оксазолінами, такими як розкриті в US-5478855, US-4639771 і DE-19520936.

5 Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з похідними й аналогами загального класу діоксоморфолінових протипаразитарних засобів, описаними у WO-9615121, а також з антигельмінтними активними циклічними депсипептидами, такими як описані у WO-9611945, WO-9319053, WO-9325543, EP-626375, EP-382173, WO-9419334, EP-382173 і EP-503538.

10 Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з іншими ектопаразитицидами; наприклад, фіпронілом; піретроїдами; фосфорорганічними сполуками; регуляторами росту комах, такими як люфенурон; агоністами екдизону, такими як тебуфенозид тощо; неонікотинідами, такими як імідаклоприд тощо.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з терпеновими алкалоїдами, описаними, наприклад, у WO 95/19363 або WO 04/72086, зокрема сполуками, розкритими в цих документах.

15 Інші приклади таких біологічно активних сполук, у комбінації з якими можна застосовувати сполуки за даним винаходом, включають без обмеження наступні. Фосфорорганічні сполуки: ацефат, азаметинос, азинфос-етил, азинфос-метил, бромосфос, бромосфос-етил, кадусафос, хлоретоксифос, хлорпірифос, хлорфенвінфос, хлормефос, деметон, деметон-S-метил, 20 деметон-S-метилсульфон, діаліфос, діазинон, дихлорвос, дикротофос, диметоат, дисульфотон, етін, етопрофос, етримфос, фамфур, фенаміфос, фенітротіон, фенсульфотіон, фентіон, флупіразофос, фонофос, формотіон, фостіазат, гептенофос, ісазофос, ізотіоат, ізоксатіон, малатіон, метакрифос, метамідофос, метидатіон, метил-паратіон, мевінфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, параоксон, паратіон, паратіон-метил, фентоат, фозалон, 25 фосфолан, фосфокарб, фосмет, фосфамідон, форат, фоксим, піриміфос, піриміфос-метил, профенофос, пропафос, проетамфос, протіофос, піраклофос, піридапентіон, квіналфос, сульпрофос, темефос, тербуфос, тебупірімфос, тетрахлорвінфос, тиметон, тіазофос, трихлорфон, вамідотіон.

Карбамати: аланікарб, альдікарб, 2-втор-бутилфенілметилкарбамат, бенфуракарб, 30 карбарил, карбофуран, карбосульфат, клоетокарб, етіофенкарб, феноксикарб, фентіокарб, фураціокарб, HCN-801, ізопрокарб, індоксакарб, метіокарб, метоміл, 5-метил-м-куменілбутирил(метил)карбамат, оксаміл, піримікарб, пропексур, тіодикарб, тіофанокс, триазамат, UC-51717.

35 Піретроїди: акринатрин, алетрин, альфаметрин, 5-бензил-3-фурилметил-(E)-(1R)-цис-2,2-диметил-3-(2-оксотіолан-3-іліденметил)циклопропанкарбоксилат, біфентрин, бета-цифлутрин, цифлутрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, біоалетрин, біоалетрин ((S)-циклопентилізомер), біоресметрин, біфентрин, NCI-85193, циклопротрин, цигалотрин, цититрин, цифенотрин, дельтаметрин, емпентрин, есфенвалерат, етофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, флювалінат (D-ізомер), іміпротрин, 40 цигалотрин, лямбда-цигалотрин, перметрин, фенотрин, пралетрин, піретрини (натуральні продукти), ресметрин, тетраметрин, трансфлутрин, тета-циперметрин, силафлуофен, тау-флювалінат, тефлутрин, тралометрин, зета-циперметрин.

Регулятори росту членистоногих: а) інгібітори синтезу хітину: бензоїлсечовини: 45 хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, тефлубензурон, трифлумурон, бупрофезин, діофенолан, гекситіазокс, етоксазол, хлорфентазин; б) антагоністи екдизону: галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид; с) ювеноїди: пірипроксифен, метопрен (зокрема, S-метопрен), феноксикарб; d) інгібітори біосинтезу ліпідів: спіродиклофен.

50 Інші протипаразитарні засоби: ацековіноцил, амітраз, AKD-1022, ANS-118, азадирахтин, *Bacillus thuringiensis*, бенсултап, біфеназат, бінапакрил, бромпропілат, BTG-504, BTG-505, камфехлор, картап, хлоробензилат, хлордимеформ, хлорфенапір, хромафенозид, клотіанідин, циромазин, діаклоден, діафентіурон, DBI-3204, динактин, дигідроксиметилдигідроксипіролідін, динобутон, динокап, ендосульфат, етипрол, етофенпрокс, феназаквін, флуміт, МТІ-800, фенпіроксимат, флуакрипірим, флубензімін, флуброцитринат, флуфензин, флуфенпрокс, 55 флупроксифен, галофенпрокс, гідраметилнон, IKI-220, канеміт, NC-196, нім гард, нідинортерфуран, нітенпірам, SD-35651, WL-108477, піридарил, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, піридабен, піримідифен, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, силафлуофен, силомадин, спіносад, тебуфенпірад, тетрадіфон, тетранактин, тіаклоприд, тіоциклам, тіаметоксам, толфенпірад, триазамат, триетоксиспіносин, трінактин, 60 вербутин, верталек, YI-5301.

Біологічні засоби: *Bacillus thuringiensis* ssp. *aizawai*, *kurstaki*, дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*, бакуловірус, ентомопатогенні бактерії, віруси та гриби.

Бактерициди: хлортетрациклін, окситетрациклін, стрептоміцин.

Інші біологічні засоби: енрофлосацин, фебантел, пенетамат, моноксикам, цефалексин, канаміцин, пімобендан, кленбутерол, омепразол, тіамулін, беназеприл, пірипрол, цефквіном, флорфенікол, бусерелін, цефовецин, тулатроміцин, цефтіофур, карпрофен, метафлумізон, празикварантел, триклабендазол.

Інший аспект даного винаходу пов'язаний із застосуванням сполуки формули (I) або переважної окремої сполуки, визначеної вище, композиції, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, визначену вище, або фунгіцидної або інсектицидної суміші, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, визначену вище, у суміші з іншими фунгіцидами або інсектицидами, описаними вище, для контролю або попередження зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, матеріалу для їх розмноження, наприклад насіння, зібраних сільськогосподарських культур, наприклад зібраних сільськогосподарських продовольчих культур або неживих матеріалів, комахами або фітопатогенними мікроорганізмами, переважно організмами, які являють собою гриби.

Додатковий аспект даного винаходу пов'язаний зі способом контролю або попередження зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, матеріалу для їх розмноження, наприклад насіння, зібраних сільськогосподарських культур, наприклад зібраних сільськогосподарських продовольчих культур або неживих матеріалів, комахами, або фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, що є потенційно шкідливими для людини, особливо організмами, які являють собою гриби, який включає застосування сполуки формули (I) або переважної окремої сполуки, визначеної вище, як активного інгредієнта щодо рослин, частин рослин або їхнього місця зростання, матеріалу для їх розмноження або щодо будь-якої частини неживих матеріалів.

Контроль або попередження означають зменшення зараження комахами, або фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини, особливо організмами, що являють собою гриби, до такого рівня, щоб було видно поліпшення.

Переважним способом контролю або попередження зараження культурних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, особливо організмами, які являють собою гриби, або комахами, який включає застосування сполуки формули (I) або агрохімічної композиції, яка містить щонайменше одну з указаних сполук, є позакореневе застосування. Частота застосування і норма застосування будуть залежати від ризику зараження відповідним патогеном або комахою. Проте проникнення сполук формули (I) в рослину можна також забезпечувати через корені з ґрунту (системна дія) шляхом зрошення місця зростання рослини рідким складом або шляхом застосування сполук у твердій формі щодо ґрунту, наприклад у гранульованій формі (внесення в ґрунт). У сільськогосподарських культурах водяного рису такі грануляти можна застосовувати щодо залитого рисового поля. Сполуки формули (I) також можна застосовувати щодо насіння (нанесення покриття) шляхом просочування насіння або бульб або рідким складом фунгіциду або шляхом покривання їх твердим складом.

Склад, наприклад композицію, що містить сполуку формули (I) і, за потреби, тверду або рідку допоміжну речовину або мономер для інкапсуляції сполуки формули (I), можна одержати відомим способом, як правило шляхом ретельного перемішування і/або подрібнення сполуки з наповнювачами, наприклад розчинниками, твердими носіями і необов'язково поверхнево-активними сполуками (поверхнево-активними речовинами).

Переважні норми застосування зазвичай становлять від 5 г до 2 кг активного інгредієнта (а. і.) на гектар (га), переважно від 10 г до 1 кг а. і./га, найбільш переважно від 20 г до 600 г а. і./га. У разі застосування як засобу для просочення насіння зручні дози становлять від 10 мг до 1 г активної речовини на кг насіння.

Якщо комбінації за даним винаходом застосовують для обробки насіння, то зазвичай достатніми є норми застосування, що становлять від 0,001 до 50 г сполуки формули (I) на кг насіння, переважно від 0,01 до 10 г на кг насіння.

Композиції за даним винаходом можна використовувати в будь-якій традиційній формі, наприклад у формі здвоєної упаковки, порошку для сухої обробки насіння (DS), емульсії для обробки насіння (ES), текучого концентрату для обробки насіння (FS), розчину для обробки насіння (LS), порошку для обробки насіння, здатного до диспергування у воді (WS), капсульної суспензії для обробки насіння (CF), гелю для обробки насіння (GF), концентрату емульсії (EC), суспензійного концентрату (SC), суспензії (SE), капсульної суспензії (CS), гранул, здатних

до диспергування у воді (WG), гранул, здатних до емульгування (EG), емульсії типу "вода-в-маслі" (EO), емульсії типу "масло-у-воді" (EW), мікроемульсії (ME), масляної дисперсії (OD), текучої речовини, здатної до змішування з маслом (OF), рідини, здатної до змішування з маслом (OL), розчинного концентрату (SL), суспензії надмалого об'єму (SU), рідини надмалого об'єму (UL), технічного концентрату (TK), концентрату, здатного до диспергування (DC), змочуваного порошку (WP) або будь-якого технічно здійсненого складу в поєднанні з прийнятними для сільського господарства допоміжними речовинами.

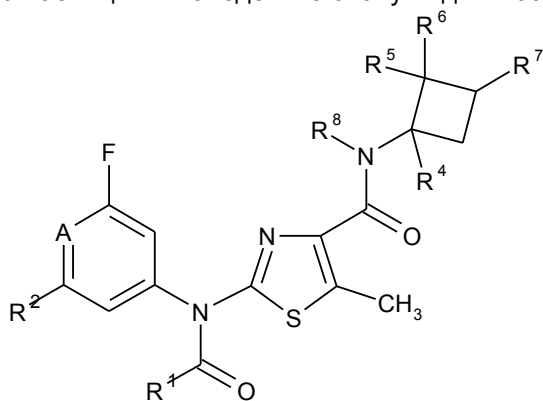
Такі композиції можуть бути одержані традиційним способом, наприклад шляхом змішування активних інгредієнтів із відповідними інертними компонентами складу (розріджувачами, розчинниками, наповнювачами і необов'язково іншими інгредієнтами складу, такими як поверхнево-активні речовини, біоциди, антифризи, клейкі речовини, загусники і сполуки, які забезпечують допоміжні ефекти). Якщо необхідна тривала дія, то можна застосовувати також традиційні склади повільного вивільнення. Зокрема, склади для застосування у формах для розпилення, такі як концентрати, здатні до диспергування у воді (наприклад, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO тощо), змочувані порошки і гранули, можуть містити поверхнево-активні речовини, такі як змочувальні та диспергуючі засоби та інші сполуки, які забезпечують допоміжні ефекти, наприклад продукт конденсації формальдегіду з нафталінсульфонатом, алкіларилсульфонат, лігнінсульфонат, алкілсульфат жирної кислоти та етоксильований алкілфенол й етоксильований жирний спирт.

Склад для протравлювання насіння застосовують способом, відомим per se, щодо насіння із використанням комбінації за даним винаходом і розріджувача у прийнятній формі складу для протравлювання насіння, наприклад, у формі водної суспензії або у формі сухого порошку, що характеризуються гарним прилипанням до насіння. Такі склади для протравлювання насіння відомі з рівня техніки. Склади для протравлювання насіння можуть містити окремі активні інгредієнти або комбінацію активних інгредієнтів в інкапсульованій формі, наприклад, у вигляді капсул або мікрокапсул повільного вивільнення.

Загалом склади містять від 0,01 до 90 % за вагою активного засобу, від 0 до 20 % прийнятної для сільського господарства поверхнево-активної речовини та від 10 до 99,99 % твердих або рідких інертних компонентів складу та допоміжної(-их) речовини(речовин), при цьому активний засіб складається щонайменше зі сполуки формули (I) разом із компонентом (B) і (C) та необов'язково інших активних засобів, зокрема мікробіоцидів або консервантів тощо. Концентровані форми композицій зазвичай містять від приблизно 2 до 80 %, переважно від приблизно 5 до 70 % за вагою активного засобу. Застосовувані форми складу можуть, наприклад, містити від 0,01 до 20 % за вагою, переважно від 0,01 до 5 % за вагою активного засобу. Оскільки комерційні продукти переважно будуть складені у вигляді концентратів, споживач буде зазвичай використовувати розведені склади.

У таблиці 1 нижче проілюстровані приклади окремих сполук формули (I) згідно з даним винаходом.

У таблиці A-1 наведені 48 сполук від A-1.001 до A-1.048 формули (Ib),



(Ib),

де A являє собою N, R⁷ являє собою водень, R¹ являє собою тетрагідрофуран-3-іл, R² являє собою водень, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁸
001	водень	водень	водень	водень
002	водень	метил	водень	водень
003	водень	водень	метил	водень
004	водень	метил	метил	водень
005	метил	водень	водень	водень
006	метил	метил	водень	водень
007	метил	водень	метил	водень
008	метил	метил	метил	водень
009	етил	водень	водень	водень
010	етил	метил	водень	водень
011	етил	водень	метил	водень
012	етил	метил	метил	водень
013	водень	водень	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
014	водень	метил	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
015	водень	водень	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
016	водень	метил	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
017	метил	водень	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
018	метил	метил	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
019	метил	водень	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
020	метил	метил	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
021	етил	водень	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
022	етил	метил	водень	тетрагідрофуран-3-карбоніл
023	етил	водень	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
024	етил	метил	метил	тетрагідрофуран-3-карбоніл
025	водень	водень	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
026	водень	метил	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
027	водень	водень	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
028	водень	метил	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
029	метил	водень	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
030	метил	метил	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
031	метил	водень	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
032	метил	метил	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
033	етил	водень	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
034	етил	метил	водень	тетрагідрофуран-2-карбоніл
035	етил	водень	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
036	етил	метил	метил	тетрагідрофуран-2-карбоніл
037	водень	водень	водень	оксетан-3-карбоніл
038	водень	метил	водень	оксетан-3-карбоніл
039	водень	водень	метил	оксетан-3-карбоніл
040	водень	метил	метил	оксетан-3-карбоніл
041	метил	водень	водень	оксетан-3-карбоніл
042	метил	метил	водень	оксетан-3-карбоніл
043	метил	водень	метил	оксетан-3-карбоніл
044	метил	метил	метил	оксетан-3-карбоніл
045	етил	водень	водень	оксетан-3-карбоніл
046	етил	метил	водень	оксетан-3-карбоніл
047	етил	водень	метил	оксетан-3-карбоніл
048	етил	метил	метил	оксетан-3-карбоніл

В таблиці A-2 наведені 48 сполук від A-2.001 до A-2.048 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою водень, R¹ являє собою тетрагідрофуран-3-іл, R² являє собою фтор, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-63 наведені 48 сполук від A-63.001 до A-63.048 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ являє собою ізопропоксиметил, R² являє собою водень, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-64 наведені 48 сполук від A-64.001 до A-64.048 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ являє собою ізопропоксиметил, R² являє собою фтор, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-65 наведені 48 сполук від A-65.001 до A-65.048 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ являє собою трет-бутоксиметил, R² являє собою водень, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-66 наведені 48 сполук від A-66.001 до A-66.048 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ являє собою трет-бутоксиметил, R² являє собою фтор, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-67 наведені 12 сполук від A-67.001 до A-67.012 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою водень, R¹ являє собою тетрагідропіран-4-іл, R² являє собою водень, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

В таблиці A-68 наведені 12 сполук від A-68.001 до A-68.012 формули (Ib), де A являє собою N, R⁷ являє собою водень, R¹ являє собою тетрагідропіран-4-іл, R² являє собою фтор, і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁸ є такими, як визначено в таблиці 1.

Приклади складів

Змочувані порошки	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	25 %	50 %	75 %
лігносульфонат натрію	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрію	3 %	-	5 %
Діізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6 %	10 %
Феноловий етер поліетиленгліколю (7-8 моль етиленоксиду)	-	2 %	-
Високодисперсна кремнієва кислота	5 %	10 %	10 %
каолін	62 %	27 %	-

Активний інгредієнт ретельно перемішують із допоміжними речовинами та суміш ретельно подрібнюють у придатному млині з одержанням змочуваних порошків, які можна розвести водою з одержанням суспензій необхідної концентрації.

Порошки для сухої обробки насіння	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	25 %	50 %	75 %
Легке мінеральне масло	5 %	5 %	5 %
Високодисперсна кремнієва кислота	5 %	5 %	-
каолін	65 %	40 %	-
Тальк	-	-	20 %

Активний інгредієнт ретельно перемішують із допоміжними речовинами та суміш ретельно подрібнюють у придатному млині з одержанням порошків, які можна застосовувати безпосередньо для обробки насіння.

Здатний до емульгування концентрат	
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	10 %
Октилфеноловий етер поліетиленгліколю (4-5 моль етиленоксиду)	3 %
Додецилбензолсульфонат кальцію	3 %
Полігліколевий етер рицинової олії (35 моль етиленоксиду)	4 %

Циклогексанон	30 %
Суміш ксилолів	50 %

Із цього концентрату шляхом розбавлення водою можна одержати емульсії будь-якого необхідного розведення, які можна застосовувати для захисту рослин.

Пилоподібні препарати	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	5 %	6 %	4 %
Тальк	95 %	-	-
каолін	-	94 %	-
Мінеральний наповнювач	-	-	96 %

5

Готові до застосування пилоподібні препарати одержують шляхом змішування активного інгредієнта з носієм і подрібнення суміші у придатному млині. Такі порошки також можна застосовувати для сухого протравлювання насіння.

Екструдовані гранули	
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	15 %
лігносульфонат натрію	2 %
карбоксиметилцелюлоза	1 %
каолін	82 %

10

Активний інгредієнт змішують і подрібнюють із допоміжними речовинами та суміш зволожують водою. Суміш екструдують і потім висушують у потоці повітря.

Покриті гранули	
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	8 %
Поліетиленгліколь (молекулярна маса 200)	3 %
каолін	89 %

15

Тонкоподрібнений активний інгредієнт у змішувальному пристрої рівномірно наносять на каолін, зволожений поліетиленгліколем. Таким чином одержують покриті гранули, що не належать до пилоподібних препаратів.

Суспензійний концентрат	
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	40 %
пропіленгліколь	10 %
Поліетиленгліколевий етер	
нонілфенолу (15 моль	6 %
етиленоксиду)	
Лігносульфонат натрію	10 %
карбоксиметилцелюлоза	1 %
Силіконове масло (у формі емульсії у воді)	1 %
вода	32 %

20

Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами з одержанням суспензійного концентрату, з якого можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення шляхом розведення водою. Шляхом застосування таких розведень живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом розпилення, поливу або занурення.

25

Текучий концентрат для обробки насіння	
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	40 %
пропіленгліколь	5 %
Співполімер бутанолу та РО/ЕО	2 %

Тристиролфенол із 10-20 моль ЕО	2 %
1,2-Бензіотіазолін-3-он (у формі 20 % розчину у воді)	0,5 %
Кальцієва сіль моноазопігменту	5 %
Силіконове масло (у формі 75 % емульсії у воді)	0,2 %
вода	45,3 %

Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами з одержанням суспензійного концентрату, з якого можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення шляхом розведення водою. Шляхом застосування таких розведень живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом розпилення, поливу або занурення.

Капсульна суспензія повільного вивільнення

28 частин комбінації сполуки формули (I) змішують із 2 частинами ароматичного розчинника та 7 частинами суміші толуолдізоціанат/поліметиленаполіфенілізоціанат (8:1). Цю суміш емульгують у суміші із 1,2 частини полівінілового спирту, 0,05 частини піногасника і 51,6 частини води до одержання частинок необхідного розміру. У цю емульсію додають суміш із 2,8 частини 1,6-діаміногексану в 5,3 частини води. Суміш перемішують до завершення реакції полімеризації.

Одержану капсульну суспензію стабілізують шляхом додавання 0,25 частини загусника та 3 частин диспергувального засобу. Склад капсульної суспензії містить 28 % активних інгредієнтів. Середній діаметр капсул становить 8-15 мікронів.

Одержаний склад застосовують щодо насіння у вигляді водної суспензії в пристрої, придатному для даної мети.

Приклади

Наступні приклади слугують для ілюстрації даного винаходу. Сполуки за даним винаходом можуть відрізнятися від відомих сполук їхньою більш високою ефективністю за низьких норм застосування, що здатний перевірити фахівець у даній галузі з використанням експериментальних методик, зазначених у прикладах, із використанням за необхідності більш низьких норм застосування, наприклад 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm або 0,2 ppm.

Сполуки формули (I) можуть характеризуватися цілою низкою переваг, у тому числі, *inter alia*, переважними рівнями біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинених грибами, або пречудовими властивостями для застосування як агрохімічно активних інгредієнтів (наприклад, більш високою біологічною активністю, переважним спектром активності, підвищеним профілем безпеки (у тому числі поліпшеною толерантністю сільськогосподарських культур), поліпшеними фізико-хімічними властивостями або підвищеною здатністю до біорозкладання).

Перелік скорочень

°C означає градуси Цельсія, CDCl₃ означає хлороформ-d, d означає дублет, DCM означає дихлорметан, DMF означає диметилформамід, HATU означає 1-[біс(диметиламіно)метиле]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]піридин-3-оксида гексафторфосфат, m означає мультиплет, МГц означає мегагерц, n. означає нормальний, к. т. означає кімнатну температуру, s означає синглет.

Загальна процедура

У всьому даному описі значення температури наведені в градусах Цельсія (°C), а "m.p." означає температуру плавлення. LC/MS означає рідинну хроматографію з мас-спектрометрією, а опис пристрою і способу є наступним:

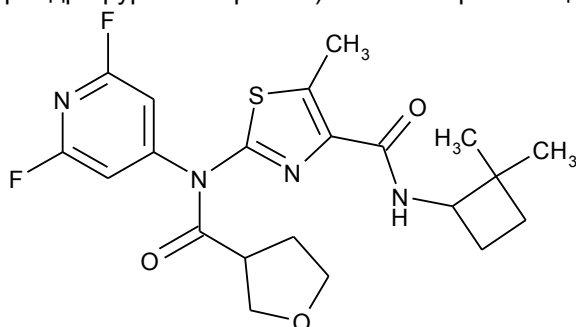
Спосіб А. ACQUITY UPLC від Waters, Waters UPLC HSS T3, розмір частинок 1,8 мм, колонка 30 × 2,1 мм, 0,85 мл/хв, 60 °C, H₂O/MeOH 95:5+0,05 % HCOOH (90 %) / CH₃CN+0,05 % HCOOH (10 %) – 1,2 хв. – CH₃CN+0,05 % HCOOH (100 %) – 0,30 хв, мас-спектрометр ACQUITY SQD від Waters, спосіб іонізації: електророзпилення (ESI), полярність: позитивні іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 30,00, напруга на екстракторі (В) 2,00, вихідна температура (°C) 150, температура десольватації (°C) 350, газовий потік в конусі (л/год.) 0, газовий потік десольватації (л/год.) 650).

Спосіб В. ACQUITY UPLC від Waters, Waters UPLC HSS T3, розмір частинок 1,8 мм, колонка 30 × 2,1 мм, 0,85 мл/хв, 60 °C, H₂O/MeOH 95:5+0,05 % HCOOH (90 %) / CH₃CN+0,05 % HCOOH (10 %) – 2,7 хв. – CH₃CN+0,05 % HCOOH (100 %) – 0,30 хв, мас-спектрометр ACQUITY SQD від Waters, спосіб іонізації: електророзпилення (ESI), полярність: позитивні іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 30,00, напруга на екстракторі (В) 2,00, вихідна температура (°C)

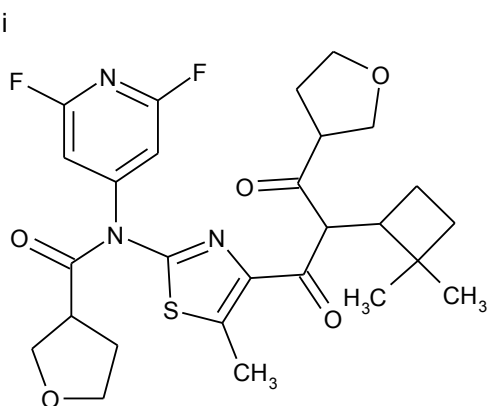
150, температура десольватації (°C) 350, газовий потік в конусі (л/год.) 0, газовий потік десольватації (л/год.) 650).

Спосіб С. Мас-спектрометр ACQUITY від Waters Corporations (одноквадрупольний мас-спектрометр SQD або SQDII), оснащений джерелом електророзпилення (полярність: позитивні або негативні іони, напруга на капілярі: 3,0 кВ, напруга на конусі: 30 В, напруга на екстракторі: 3,00 В, температура джерела: 150 °C, температура десольватації: 400 °C, витрата газу в конусі: 60 л/год., витрата газу для десольватації: 700 л/год., діапазон мас: 140-800 Да) та Acquity UPLC від Waters Corporations з дегазатором розчинника, насосом для двокомпонентних сумішей, відсіком колонки, що нагрівається, та детектором на діодній матриці. Колонка: Waters UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм, температура: 60 °C, діапазон значень довжини хвилі DAD (нм): від 210 до 400, градієнт розчинника: А = вода/метанол 9:1+0,1 % мурашиної кислоти, В = ацетонітрил + 0,1 % мурашиної кислоти, градієнт: 0-100 % В за 2,5 хв.; витрата (мл/хв) 0,75.

Приклад 1. Одержання 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (приклад Р-2, таблиця 2) і 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)тіазол-4-карбоксаміду (приклад Р-1, таблиця 2)



(Сполука Р-3, таблиця 2)



(Сполука Р-1, таблиця 2)

Розчин тетрагідрофуран-3-карбонової кислоти (0,174 г, 0,143 мл, 1,48 ммоль) в DCM (9 мл) в атмосфері аргону обробляли за допомогою 1 краплі DMF з наступним додаванням оксалілхлориду (0,192 г, 0,13 мл, 1,48 ммоль). Суміш перемішували протягом 30 хвилин при к. т. в атмосфері аргону з одержанням тетрагідрофуран-3-карбонілхлориду. До даного розчину в DCM додавали 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (0,350 г, 0,993 ммоль, одержаний, як описано в WO 2019/105933) з наступним додаванням триетиламіну (0,308 г, 0,42 мл, 2,98 ммоль) в атмосфері аргону при к. т. Одержаний блідо-жовтий розчин перемішували протягом 2,5 годин в атмосфері аргону при к. т. Після закінчення цього часу LCMS аналіз показав завершення реакції. Реакційну суміш обробляли за допомогою Isolute® і концентрували in vacuo. В результаті очищення за допомогою флеш-хроматографії з елюванням за допомогою суміші етилацетат/циклогексан одержували суміш двох продуктів, яку додатково очищували шляхом хроматографії з оберненою фазою з одержанням як першого елюйованого продукту 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (приклад Р-2, таблиця 2) у вигляді білого порошку.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ ppm 0,94 (s, 3 H) 1,13 (s, 3 H) 1,49-1,59 (m, 2 H) 1,65-1,78 (m, 1 H) 1,95-2,15 (m, 1 H) 2,19-2,30 (m, 1 H) 2,30-2,40 (m, 1 H) 2,81 (s, 3 H) 2,99-3,14 (m, 1 H) 3,80-3,88 (m, 1 H) 3,88-3,95 (m, 1 H) 3,95-4,06 (m, 2 H) 4,10-4,26 (квадруплет, 1 H) 6,89 (s, 2 H) 6,95-7,06 (широкий d, 1 H);

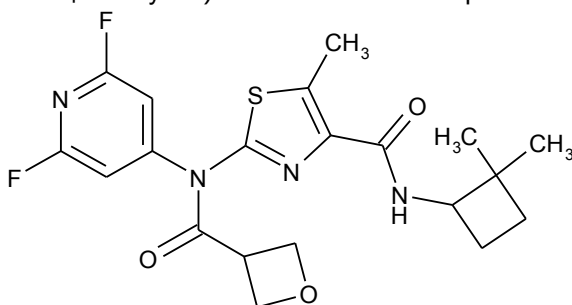
LC-MS (спосіб А): 451 [M+H], Rt: 1,09 хв.

В результаті додаткового елюювання одержували другий продукт, 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)тіазол-4-карбоксамід, (сполука Р-1, таблиця 2) у вигляді білого порошку.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ ppm 1,09 (s, 3 H) 1,18 (s, 3 H) 1,53-1,66 (m, 2 H) 1,77-1,91 (m, 1 H) 2,07-2,22 (m, 2 H) 2,23-2,34 (m, 1 H) 2,41-2,51+2,62-2,71 (2 x m, 2 H) 2,81 (s, 3 H) 3,10-3,26 (m, 1 H) 3,77-4,05 (m, 6 H) 4,14-4,31+4,37-4,43 (2 x m, 3 H) 6,81-6,92 (2 x s, 2 H) 7,20 (br d, J=8,44 Гц, 1 H);

LC-MS (спосіб А): 549 [M+H], Rt: 1,15 хв.

Приклад 2. Одержання 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(оксетан-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (приклад Р-4, таблиця 2)



(Приклад Р-4, таблиця 2)

Розчин 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (0,050 г, 1,0, 0,14 ммоль, одержаного, як описано в WO 2019/105933), в DMF (1,4 мл) обробляли оксетан-3-карбоною кислотою (0,019 г, 1,2, 0,17 ммоль), N, N-диізопропілетиламіном (0,048 г, 0,064 мл, 0,37 ммоль) і HATU (0,082 г, 0,21 ммоль). Одержаний блідо-коричневий розчин перемішували протягом 4 годин при к. т. Після закінчення цього часу реакційну суміш гасили насиченим водним розчином бікарбонату натрію і розбавляли водою. Потім її екстрагували двічі за допомогою етилацетату, і об'єднані органічні шари промивали сольовим розчином, висушували над безводним Na₂SO₄, фільтрували і концентрували in vacuo з одержанням блідо-коричневого масла. Неочищений продукт очищали шляхом хроматографії з оберненою фазою з елююванням за допомогою суміші ацетонітрил/вода з одержанням вказаної в заголовку сполуки у вигляді бежевого порошку.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ ppm 0,97 (s, 3 H) 1,14 (s, 3 H) 1,50-1,65 (m, 2 H) 1,65-1,81 (m, 1 H) 2,19-2,34 (m, 1 H) 2,84 (s, 3 H) 3,86-4,01 (m, 1 H) 4,13-4,26 (m, 1 H) 4,51-4,65 (m, 2 H) 4,92-5,06 (m, 2 H) 6,82 (s, 2 H) 6,91-7,08 (br s, 1 H);

LC-MS (спосіб А): 437 [M+H], Rt: 1,05 хв.

Приклад 3. Одержання 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідропіран-4-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (приклад Р-11, таблиця 2)

Розчин тетрагідро-2h-піран-4-карбоної кислоти (6,282 г, 46,82 ммоль) в ацетонітрилі (86 мл) обробляли ангідридом 1-пропанфосфонові кислоти (99,32 г, 93,00 мл, 156,1 ммоль), N, N-диізопропілетиламіном (40,75 г, 54,6 мл, 10,00, 312,1 ммоль) і додавали 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (11 г, 1,000, 31,21 ммоль, одержаний, як описано в WO 2019/105933) з одержанням коричневого розчину. Реакційну суміш перемішували протягом 16 год. при 50 °C в атмосфері аргону. Після завершення реакції забезпечували охолодження реакційної суміші і повільно додавали у водний насичений розчин бікарбонату натрію при 0 °C. Реакційну суміш потім екстрагували за допомогою етилацетату (x3) і об'єднані органічні екстракти промивали один раз сольовим розчином, висушували над безводним Na₂SO₄, фільтрували і концентрували in vacuo з одержанням 15,88 г блідо-коричневого порошку. За допомогою флеш-хроматографії з елююванням за допомогою суміші етилацетат/циклогексан одержували вказаний в заголовку продукт у вигляді білого порошку. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ ppm 0,93 (s, 3 H) 1,13 (s, 3 H) 1,50-1,76 (m, 5 H) 1,97-2,09 (m, 2 H) 2,25 (dtd, J=10,90, 8,08, 8,08, 2,72 Гц, 1 H) 2,60 (tt, J=11,26, 3,81 Гц, 1 H) 2,81 (s, 3 H) 3,29 (tt, J=11,90, 1,91 Гц, 2 H) 4,01 (dt, J=11,63, 2,18 Гц, 2 H) 4,18 (q, J=8,60 Гц, 1 H) 6,89 (s, 2 H) 6,99 (br d, J=9,08 Гц, 1 H)

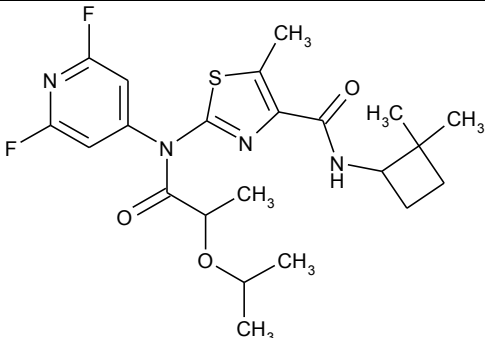
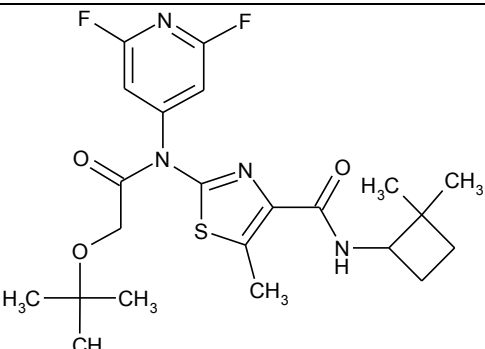
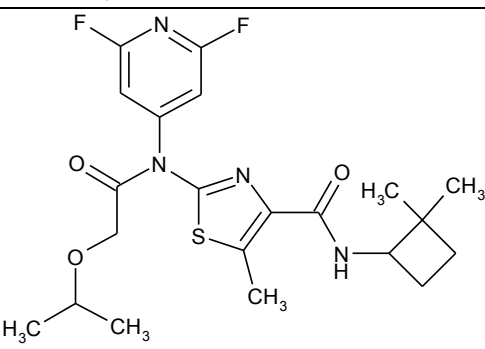
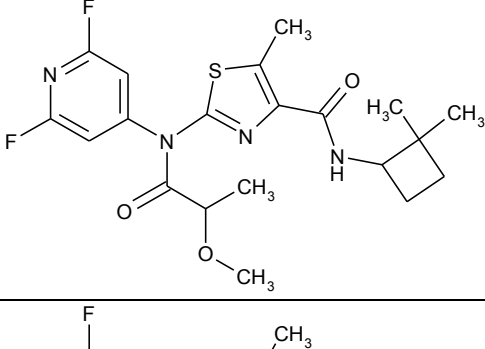
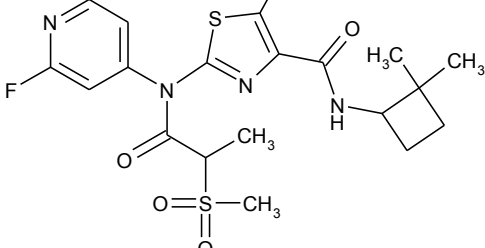
LC-MS (спосіб А): 465 [M+H], Rt: 1,11 хв.

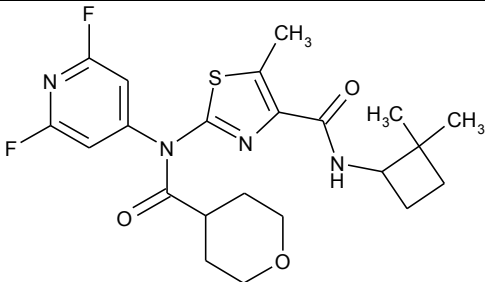
В таблиці 2 нижче проілюстровані окремі сполуки формули (I) як приклад згідно з даним винаходом.

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
P-1	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,15$ хвилини (A); MS: маса/заряд = 549 (M+1)
P-2	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,13$ хвилини (A); MS: маса/заряд = 451 (M+1)
P-3	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,09$ хвилини (A); MS: маса/заряд = 451 (M+1)
P-4	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(оксетан-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,05$ хвилини (A); MS: маса/заряд = 437 (M+1)
P-5	2-[2-трет-бутоксипропанол-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		107-112	$R_t=1,22$ хвилини (A); MS: маса/заряд = 481 (M+1)

P-6	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксипропаноїл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			R _t =1,20 минуты (A); MS: масса/заряд = 467 (M+1)
P-7	2-[(2-трет-бутоксиацетил)-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		159-161	R _t =1,20 минуты (A); MS: масса/заряд = 467 (M+1)
P-8	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксиацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		170-172	R _t =1,16 минуты (A); MS: масса/заряд = 453 (M+1)
P-9	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метоксипропаноїл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			R _t =1,12 минуты (A); MS: масса/заряд = 439 (M+1)
P-10	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метилсульфонілпропаноїл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			R _t =1,02 минуты (A); MS: масса/заряд = 487 (M+1)

P-11	2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідропіран-4-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід		R _t =1,11 минуты (А); MS: масса/заряд = 465 (M+1)
------	--	--	--

Біологічні приклади

Приклад В1. *Alternaria solani* / томат / листковий диск (альтернаріоз)

Листові диски томату сорту Baby поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 23 °C/21 °C (день/ніч) і відносної вологості 80 % за світлового режиму 12/12 год. (світла/темряви) у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом під час виявлення відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених листових дисках, які являють собою контрольні диски (5-7 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Alternaria solani* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 і P-11.

Приклад В2. *Botryotinia fuckeliana* (*Botrytis cinerea*) / рідка культура (сіра гниль)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (бульйон Фогеля). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 3-4 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Botryotinia fuckeliana* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-2 і P-4.

Приклад В3. *Glomerella lagenarium* (*Colletotrichum lagenarium*) / рідка культура (антракноз)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту вимірювали фотометрично через 3-4 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Glomerella lagenarium* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-6, P-9, P-10 і P-11.

Приклад В4. *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) / пшениця / попередження зараження листового диску (борошниста роса пшениці)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали шляхом струшування заражених борошнистою росою рослин над досліджуваними планшетами через 1 день після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 20 °C і відносної вологості 60 % за світлового режиму 24 год. темряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (6-8 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-8, P-9, P-10 і P-11.

Приклад В5. *Phaeosphaeria nodorum* (*Septoria nodorum*) / пшениця / попередження зараження листового диску (септоріоз колоскової луски)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані досліджувані листові диски інкубували за 20 °C і відносної вологості 75 % за світлового режиму

12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних листових дисках (5-7 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Phaeosphaeria podorum* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-2, P-3 і P-10.

Приклад B6. *Monographella nivalis* (*Microdochium nivale*) / рідка культура (коренева гниль злакових)

Конідії грибів із кріогенного сховища безпосередньо змішували із поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Monographella nivalis* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 і P-11.

Приклад B7. *Mycosphaerella arachidis* (*Cercospora arachidicola*) / рідка культура (ранній церкоспороз листя)

Конідії грибів із кріогенного сховища безпосередньо змішували із поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Mycosphaerella arachidis* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2 і P-10.

Приклад B8. *Phakopsora pachyrhizi* / соя / попередження (іржа сої)

Листові диски сої поміщали на водний агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Через день після застосування листові диски інокулювали шляхом розприскування суспензії спор на нижню поверхню листка. Після періоду інкубації у кліматичній камері, що становив 24-36 год., в темряві за 20 °C та відносної вологості 75 % листові диски витримували за 20 °C із 12 год. світла/дня та відносною вологістю 75 %. Активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних листових дисках (12-14 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Phakopsora pachyrhizi* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-2, P-3, P-4, P-6 і P-9.

Приклад B9. *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / пшениця / лікування зараження листового диску (бура іржа)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат). Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба. Планшети зберігали в темряві за 19 °C і відносної вологості 75 %. Препарат досліджуваної сполуки, розведеної у воді, застосовували через 1 день після інокуляції. Сегменти листків інкубували за 19 °C та відносної вологості 75 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (6-8 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9 і P-11.

Приклад B10. *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / пшениця / попередження зараження листового диску (бура іржа)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листкові диски інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 19 °C та відносної вологості 75 % за світлового

режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (7-9 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Russinia recondita* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-9, P-10 і P-11.

Приклад B11. *Magnaporthe grisea* (*Pyricularia oryzae*) / рис / попередження зараження листового диску (пірикуляріоз рису)

Сегменти листків рису сорту *Ballila* поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 22 °C і відносної вологості 80 % за світлового режиму 24 год. темряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (5-7 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Magnaporthe grisea* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-8, P-9 і P-10.

Приклад B12. *Pyrenophora teres* / ячмінь / попередження зараження листового диску (сітчаста плямистість)

Сегменти листків ячменю сорту *Hasso* поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 20 °C та відносної вологості 65 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (5-7 днів після застосування). Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Pyrenophora teres* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 і P-11.

Приклад B13. *Sclerotinia sclerotiorum* / рідка культура (біла гниль)

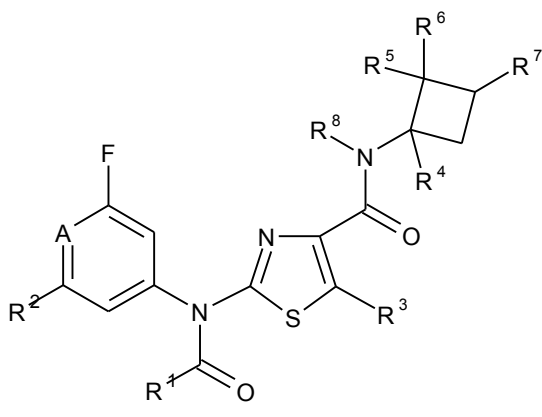
Фрагменти міцелію нещодавно вирощеної рідкої культури гриба безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить грибний матеріал. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 3-4 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Sclerotinia sclerotiorum* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-10.

Приклад B14. *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) / рідка культура (септоріоз)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували із поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 дні після застосування. Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Mycosphaerella graminicola* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: P-1, P-2, P-3, P-4, P-9, P-10 і P-11.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I):



де

A являє собою N;

5 R¹ являє собою ізопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-ізопропоксіетил, 1-трет-бутоксіетил, 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл або тетрагідропіран-4-іл;

R² являє собою галоген;

R³ являє собою C₁-C₈алкіл;

10 R⁴ являє собою водень;

кожен з R⁵, R⁶, незалежно, являє собою водень або C₁-C₄алкіл;

R⁷ являє собою водень;

R⁸ являє собою водень;

або її сіль.

15 2. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою 1-метилсульфонілетил, оксетан-3-іл, тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл або тетрагідропіран-4-іл.

3. Сполука за п. 1 або 2, де R² являє собою фтор.

4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, де R³ являє собою метил.

5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, де R⁵ і R⁶, одночасно, являють собою метил.

20 6. Сполука за п. 1, яка вибрана із наступних:

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-2);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідрофуран-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-3);

25 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(оксетан-3-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-4);

2-[2-трет-бутоксипропанол-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-5);

30 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксипропанол)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-6);

2-[(2-трет-бутоксіацетил)-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-7);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-ізопропоксіацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-8);

35 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метоксипропанол)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-9);

2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метилсульфонілпропанол)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-10); та

40 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(тетрагідропіран-4-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід (P-11).

7. Агрохімічна композиція, що містить сполуку за будь-яким із пп. 1-6.

8. Агрохімічна композиція за п. 7, що додатково містить щонайменше один додатковий активний інгредієнт та/або агрохімічно прийнятний розріджувач або носій.

45 9. Спосіб здійснення контролю або попередження зараження корисних рослин фітопатогенними грибами, за яким на рослини, на їхні частини або на місце їх зростання наносять фунгіцидно ефективну кількість сполуки за будь-яким з пп. 1-6 або композиції за п. 7 або 8.

