



(19) **UA** (11) **78 361** (13) **C2**
 (51)МПК

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
 УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ
 ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: а200502218, 08.08.2003

(24) Дата начала действия патента: 15.03.2007

(30) Приоритет: 12.08.2002 EP 02356159.0
 29.04.2003 FR 0305233

(46) Дата публикации: 15.03.2007A01N 43/40
 20070101AFI20070115RMUA C07D
 213/40 20070101ALI20070115RMUA
 C07D 213/61
 20070101ALI20070115RMUA C07D
 213/89 20070101ALI20070115RMUA

(86) Заявка РСТ:
 РСТ/EP2003/009516, 20030808

(72) Изобретатель:

Мэнсфилд Даррен Джеймс, GB,
 Кук Трэйси, GB,
 Томас Питер Стэнли, GB,
 Кокерон Пьер-Ив, FR,
 Вор Жан-Пьер, FR,
 Бриггс Джеффри Гавер, GB,
 Ляшез Элен, FR,
 Рик Хайко, DE,
 Десборде Филипп, FR,
 Гросжан-Курнуае Мари-Клер, FR

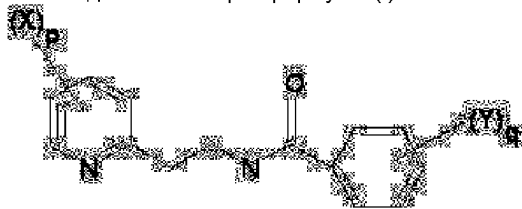
(73) Патентовладелец:

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС СА, FR

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 2-ПИРИДИЛЭТИЛБЕНЗАМИДА И СПОСОБ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ, ФУНГИЦИДНЫЕ КОМПОЗИЦИИ НА ИХ ОСНОВЕ И СПОСОБ БОРЬБЫ С ФИТОПАТОГЕННЫМИ ГРИБАМИ СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫХ КУЛЬТУР

(57) Реферат:

Соединение общей формулы (I):



в которой p - это целое число и означает 1, 2, 3 или 4; q - это целое число и означает 1, 2, 3, 4 или 5; каждый X независимо выбран из галогена, алкила или галогеналкила, и по крайней мере один X является галогеналкилом; любой Y независимо выбран из галогена, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, алкокси, амино, фенокси, алкилтио, диалкиламино, ацила, циана, эфира, гидроксид, аминоксид, бензила, галогеналкокси, галогенсульфонила,

галогентиоалкила, алкоксиалкенила, алкилсульфонамида, нитро, алкилсульфонила, фенилсульфонила или бензилсульфонила; а также их N-оксиды 2-замещенного пиридина; за исключением

N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-пиридинил]этил}-2,6-дихлорбензамида. Способ получения соединений общей формулы (I). Фунгицидная композиция, включающая соединения общей формулы (I) и способ предупреждения или борьбы с фитопатогенными грибами сельскохозяйственных культур с помощью этой фунгицидной композиции.

Официальный бюллетень "Промышленная собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные модели, топографии интегральных микросхем", 2007, N 3, 15.03.2007. Государственный департамент интеллектуальной собственности Министерства образования и науки Украины.

UA 78361 C2

UA 78361 C2



(19) **UA** (11) **78 361** (13) **C2**
 (51) Int. Cl.

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF
 UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL
 PROPERTY

(12) **DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION**

(21), (22) Application: a200502218, 08.08.2003

(24) Effective date for property rights: 15.03.2007

(30) Priority: 12.08.2002 EP 02356159.0
 29.04.2003 FR 0305233

(46) Publication date: 15.03.2007A01N 43/40
 20070101AFI20070115RMUA C07D
 213/40 20070101ALI20070115RMUA
 C07D 213/61
 20070101ALI20070115RMUA C07D
 213/89 20070101ALI20070115RMUA

(86) PCT application:
 PCT/EP2003/009516, 20030808

(72) Inventor:

Mansfield Darren James, GB,
 Cooke Tracey, GB,
 Thomas Peter Stanley, GB,
 Coqueron Pierre-Yves, FR,
 Vors Jean-Pierre, FR,
 Briggs Geoffrey Gower, GB,
 Lachaise Helene, FR,
 Rieck Heiko, DE,
 Desbordes Philippe, FR,
 Grosjean-Cournoyer Marie-Clair, FR

(73) Proprietor:

BAYER CROPSCIENCE SA, FR

(54) 2-PYRIDYLETHYLBENZAMIDE DERIVATIVES AND METHOD OF PREPARATION THEREOF, FUNGICIDAL COMPOSITIONS BASED THEREON AND METHOD OF CONTROLLING PHYTOPATHOGENIC FUNGI OF FARM CROPS

(57) Abstract:

Compound of general formula (I) in which p is an integer equal to 1, 2, 3 or 4; q is an integer equal to 1, 2, 3, 4 or 5; each substituent X is chosen, independently of the others, as being halogen, alkyl or haloalkyl, at least one of the substituents being a haloalkyl; each substituent Y is chosen, independently of the others, as being halogen, alkyl, alkenyl alkynyl, haloalkyl, alkoxy, amino, phenoxy, alkylthio, dialkylamino, acyl, cyano, ester, hydroxy, aminoalkyl, benzyl, haloalkoxy, halosulphonyl, halothioalkyl, alkoxyalkenyl, alkylsulphonamide, nitro, alkylsulphonyl, phenylsulphonyl or

benzylsulphonyl; as to the N-oxides of 2-pyridine thereof; with the exception of N-{2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]-ethyl}-2,6-dichlorobenzamide. Method for preparing the compound of general formula (I). Fungicidal composition comprising the compound of general formula (I). Method for treating phytopathogenic diseases.

Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2007, N 3, 15.03.2007. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.

UA 78361 C2

UA 78361 C2



(19) **UA** (11) **78 361** (13) **C2**
 (51)МПК

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
 ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:
 а200502218, 08.08.2003

(24) Дата набуття чинності: 15.03.2007

(30) Дані стосовно пріоритету відповідно до Паризької конвенції : 12.08.2002 EP 02356159.0
 29.04.2003 FR 0305233

(46) Публікація відомостей про видачу патенту (деклараційного патенту): 15.03.2007A01N 43/40
 20070101AFI20070115RMUA C07D
 213/40 20070101ALI20070115RMUA
 C07D 213/61
 20070101ALI20070115RMUA C07D
 213/89 20070101ALI20070115RMUA

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки відповідно до договору РСТ:
 РСТ/EP2003/009516, 20030808

(72) Винахідник(и):

Менсфілд Даррен Джеймс, GB,
 Кук Трейсі , GB,
 Томас Пітер Стенлі, GB,
 Кокерон П'єр-Ів , FR,
 Вор Жан-П'єр , FR,
 Бріггс Джефрі Гавер, GB,
 Ляшез Елен , FR,
 Рік Хайко , DE,
 Десборде Філіпп , FR,
 Гросжан-Курнуає Марі-Клер , FR

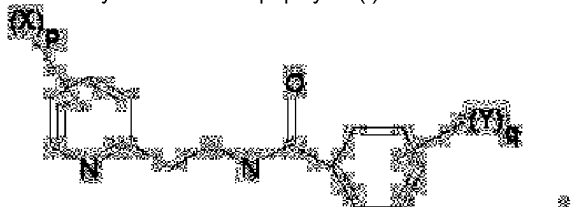
(73) Власник(и):

БАЙЄР КРОПСАЙНС СА, FR

(54) ПОХІДНІ 2-ПІРИДИЛЕТИЛБЕНЗАМІДУ ТА СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ФУНГІЦИДНІ КОМПОЗИЦІЇ НА ЇХ ОСНОВІ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИХ КУЛЬТУР

(57) Реферат:

Сполука загальної формули (I):



в якій p - це ціле число та означає 1, 2, 3 або 4; q - це ціле число та означає 1, 2, 3, 4 або 5; кожен X незалежно вибраний з галогену, алкілу або галогеналкілу, та принаймні один X є галогеналкілом; кожний Y незалежно вибраний з галогену, алкілу, алкенілу, алкінілу,

галогеналкілу, алкокси, аміно, фенокси, алкілію, діалкіламіно, ацилу, ціану, ефіру, гідрокси, аміноалкілу, бензилу, галогеналкокси, галогенсульфонілу, галогентіоалкілу, алкоксіалкенілу, алкілсульфонамід, нітро, алкілсульфонілу, фенілсульфонілу або бензилсульфонілу; а також їх N-оксиди 2-заміщеного піридину; за винятком N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2,6-дихлорбензаміду. Спосіб одержання сполук загальної формули (I). Фунгіцидна композиція, що включає сполуки загальної формули (I) та спосіб попередження або боротьби з фітопатогенними грибами сільськогосподарських культур за допомогою цієї фунгіцидної композиції.

U A 7 8 3 6 1 C 2

U A 7 8 3 6 1 C 2

Опис винаходу

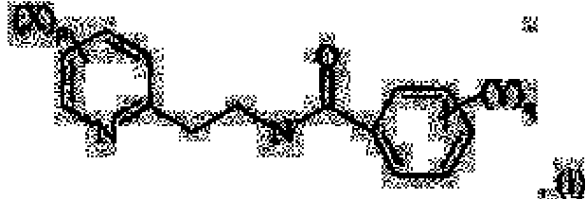
Даний винахід відноситься до нових фунгіцидних сполук, способу їх одержання, до фунгіцидних композицій, що містять ці сполуки, а також до їх використання в сільському господарстві як фунгіцидів.

Заявка на патент WO 01/11965 описує широку групу фунгіцидних сполук загальної формули, що включає і сполуки даного винаходу. Проте, заявлені сполуки не описані в тій заявці на патент, та їх активність як фунгіцидів не була перевірена.

Це є завжди корисно в сільському господарстві, коли використовують сполуки, які більш активні, ніж вже відомі з рівня техніки, з метою зменшення кількості активної речовини, яку використовує фермер, одночасно підтримуючи ефективність принаймні еквівалентну до ефективності вже відомих сполук.

Було знайдено, що певна кількість сполук, вибраних з широкої групи сполук, володіє вище згаданими перевагами.

Об'єктом даного винаходу таким чином є група фунгіцидних сполук загальної формули (I):



в якій:

- p - це ціле число та означає 1, 2, 3 або 4;

- q - це ціле число та означає 1, 2, 3, 4 або 5;

- кожен X незалежно вибраний з галогену, алкілу або галогеналкілу, та принаймні один X є галогеналкілом;

- кожний Y незалежно вибраний з галогену, алкілу, алкенілу, алкінілу, галогеналкілу, алкокси, аміно, фенокси, алкілтію, діалкіламіно, ацилу, ціану, ефіру, гідрокси, аміноалкілу, бензилу, галогеналкокси, галогенсульфонілу, галогентіоалкілу, алкоксіалкенілу, алкілсульфонаміду, нітро, алкілсульфонілу, фенілсульфонілу або бензилсульфонілу;

а також їх N-оксиди 2-заміщеного піридину;

за винятком N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2,6-дихлорбензаміду.

В контексті даного винаходу, замісники X у 2-заміщеному піридині та замісники Y у бензолному кільці були індексовані для того, щоб полегшити розуміння. Тому, наприклад, якщо p означає 2 та q означає 1, замісники, що позначаються як "X" означатимуть X¹ та X² та замісник, що позначається як "Y" означатиме Y¹.

У рамках даного винаходу галоген означає хлор, бром, йод або флуор.

У рамках даного винаходу кожний з радикалів алкіл або ацил в молекулі містить від 1 до 10 атомів вуглецю, переважно від 1 до 7 атомів вуглецю, більш переважно, від 1 до 5 атомів вуглецю, та можуть бути лінійними або розгалуженими.

У рамках даного винаходу кожний з радикалів алкеніл або алкініл в молекулі містить від 2 до 10 атомів вуглецю, переважно, від 2 до 7 атомів вуглецю, більш переважно, від 2 до 5 атомів вуглецю, та можуть бути лінійними або розгалуженими.

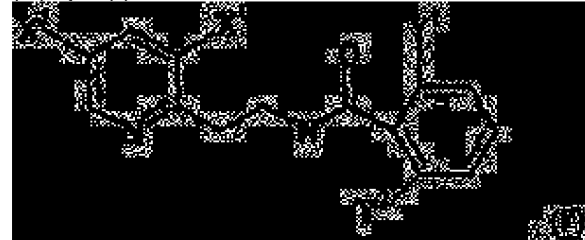
Даний винахід відноситься до сполук загальної формули (I). Переважно, сполуки загальної формули (I), які мають наступні особливості, узяті індивідуально або в комбінації:

- p означає 2, замісники X¹ та X² займають положення, як вказано нижче:



- q означає 1 або 2, замісник(и) Y знаходяться в орто положенні бензолного кільця.

Згідно винаходу перевага надається підгрупі сполук, яка складається зі сполук, що відповідає загальній формулі (I')



X та Y мають значення, як визначено вище. Більш краще, коли X¹ являє собою галоген та X² являє собою галогеналкіл.

Також згідно винаходу перевага надається підгрупі сполук, яка складається зі сполук, що відповідає загальній формулі (I'')

5



замісники X та Y мають значення, як визначено вище. Більш бажані сполуки загальної формули (I'') згідно даного винаходу, які мають наступні особливості, узяті індивідуально або в комбінації:

10

- X¹ являє собою галоген та X² являє собою галогеналкіл;
- Y¹ являє собою галоген або галогеналкіл.

Найбільш бажаний радикал - це трифлуорметил, який вибраний з галогеналкілу.

А найбільш краще, коли об'єктом даного винаходу є наступні сполуки:

15

- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-трифлуорметилбензамід;
- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-йодбензамід;
- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-бромбензамід.

Даний винахід також відноситься до способу одержання сполук загальної формули (I). Тому, згідно подальшого аспекту, даний винахід представляє спосіб одержання сполук формули (I) який містить такі стадії:

20

- на першій стадії здійснюють взаємодію, при наявності основи в апротонному полярному розчиннику, сполуки загальної формули (Ia) для того, щоб ввести вибірково замісник у 2-положення:

* з будь-якою групою типу алкілціанацетату (NC-CH₂-CO₂Alk), з одержанням сполуки загальної формули (Ib) згідно наступної схеми:

25



30

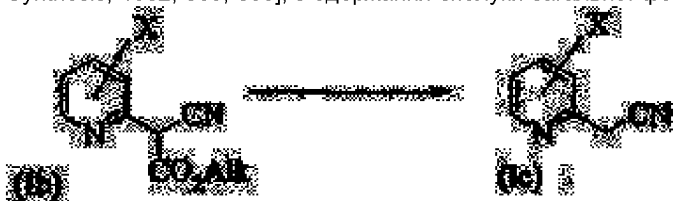
де:

- X - визначено вище;
- Alk означає радикал алкіл;
- Q - це нуклеофуг, переважно, вибраний з галогену або трифлуорметансульфонату;

35

таким чином отримані сполуки загальної формули (Ib), потім піддають деалкілоксикарбонілюванню при наявності галогенідів лужних металів, як наприклад Li-галогенід, K-галогенід або Na-галогенід, при кип'ятінні із зворотним холодильником у вода/диметилсульфоксид розчині, згідно Крапчо реакції, описаної в [A.P. Synthesis, 1982, 805, 893], з одержанням сполуки загальної формули (Ic) згідно наступної схеми:

40



45

галогенід натрію найкраще використовувати в контексті даного винаходу;

* або безпосередньо з ацетонітрилом, з одержанням сполуки загальної формули (Ic) згідно наступної схеми:

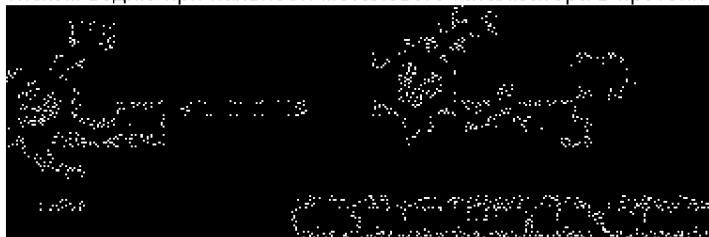
50



55

- на другій стадії здійснюють відновлення сполуки загальної формули (Ic) до піридинетанаміну загальної формули (Id) (або відповідно до його солі амонію залежно від того чи є, або ні середовище кислотним) під тиском водню при наявності металевого каталізатора в протонному розчиннику згідно наступної схеми:

60



65

- на третій стадії здійснюють перетворення сполуки загальної формули (Id) у сполуку загальної формули (I) реакцією з бензоїлгалогенідом при наявності основи згідно наступної схеми:

5



10

Другий крок вищеописаного процесу проводиться при наявності металевого каталізатора. Переважно, металевий каталізатор вибирають на основі нікелю, платини або паладію.

Третій крок вищезгаданого процесу проводиться при наявності бензоїлгалогеніду. Переважно, з бензоїлгалогенідів вибирають бензоїлхлорид.

15

Із сполуки загальної формули (I), яку отримали способом, описаним вище, середній спеціаліст, буде здатний одержати завдяки методам, відомим йому, похідні N-оксиду 2-заміщеногопіридину. Наприклад, сполуку загальної формули (I), яку отримали способом згідно даного винаходу, можна обробити надлишком мета-хлорнадбензойної кислоти (також названої m-CPBA) у розчиннику, який може бути хлороформом, при температурі від 60 до 80°C.

20

Даний винахід також відноситься до фунгіцидної композиції, яка містить ефективну кількість активної сполуки загальної формули (I). Тому даний винахід представляє фунгіцидну композицію, що містить як активний інгредієнт, ефективну кількість сполуки загальної формули (I) як визначилося вище, та сільськогосподарсько прийнятні підкладки, носії або наповнювач.

25

У даному контексті, термін "підкладка" означає природний або синтетичний, органічний або неорганічний матеріал, з яким активна речовина змішана, що полегшує її застосування, особливо до частин рослини. Тому, ця підкладка взагалі інертна та повинна бути сільськогосподарсько прийнятною. Підкладка може бути твердою речовиною або рідиною. Приклади відповідних підкладок включають глини, природні або синтетичні силікати, кремнезем, смоли, віск, тверді фертилізери, воду, спирти, зокрема бутанол, органічні розчинники, мінеральні та рослинні масла та інше. Суміші з підкладок можуть також використовуватися.

30

Композиція може також включати додаткові компоненти. Зокрема, композиція може крім того включати поверхнево-активні речовини. Поверхнево-активна речовина може бути емульгатором, дисперсійним агентом або зволожуючим агентом іонного або неіонного типу, або суміш таких поверхнево-активних речовин. Можна згадати, наприклад, солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонові кислоти, солі фенолсульфонові або нафтилсульфонові кислоти, полікоденсати оксиду етилену з жирними спиртами або з жирними кислотами, або з жирним амінами, заміщені феноли (зокрема алкілфеноли або арилфеноли), солі ефірів сульфобурштинової кислоти, похідні таурину (зокрема алкілтаурати), фосфорні ефіри поліоксіетильованих спиртів або фенолів, жирні ефіри поліолів (високомолекулярних спиртів), та похідні згаданих вище сполук, що містять сульфат, сульфонат та фосфат групи. Присутність принаймні однієї поверхнево-активної речовини взагалі необхідна, коли активна речовина та/або інертна підкладка є нерозчинними у воді, та коли агент перенесення - це вода.

40

Переважно, вміст поверхнево-активної речовини може складати від 5 до 40мас.% композиції. Необов'язково, додаткові компоненти можуть також включати, наприклад захисні колоїди, зв'язуючі речовини, коагулянти, тиксотропні агенти, агенти проникнення, стабілізатори, ізолюючі агенти. Більш загалом, активні речовини можуть поєднуватися з будь-якою твердою або рідкою добавкою, яка підкоряється звичайним методам формулювання.

45

Взагалі композиція згідно винаходу може містити від 0,05 до 99мас.% активної сполуки, краще від 10 до 70мас.%.

50

Композиції згідно даного винаходу можуть використовуватися в різних формах, як наприклад у формі аерозольного дозатору, у формі капсульної суспензії, у формі холодного дрібно-краплинного зрошення, у формі пилоподібного порошку, у формі емульгуючого концентрату, у формі емульсії масла у воді, у формі емульсії води в маслі, у формі інкапсульованої гранули, у формі дрібно-зернистих гранул, у формі текучого концентрату для оброблення зерна, у формі газу (під тиском), у формі продукту, що генерує газ, у формі гранул, у формі гарячого дрібно-краплинного зрошення, у формі макрогранул, у формі мікрогранул, у формі масляно-дисперсного порошку, у формі масляного, що змішується, текучого концентрату, у формі масляної, що змішується рідини, у формі пасти, у формі рослинних рейок, у формі порошку для сухого оброблення зерна, у формі зерна, покритого пестицидом, у формі розчинного концентрату, у формі розчинного порошку, у формі розчину для оброблення зерна, у формі суспензії концентрату (текучого концентрату), у формі наднизького об'єму (ulv) рідини, у формі наднизького об'єму (ulv) суспензії, у формі водно-дисперсних гранул або пігулок, у формі водно-дисперсного порошку для суспензійного оброблення, у формі водно-розчинних гранул або пігулок, у формі водно-розчинного порошку для оброблення зерна та у формі порошку, що змочується.

60

Ці композиції включають не тільки композиції, які готові до застосування до рослин або зерна, які обробляються за допомогою відповідного пристрою, як наприклад пристрій для зрошення або пристрій для обпилювання, але і сконцентровані комерційні композиції, які повинні бути розбавлені перед застосуванням до сільськогосподарських культур.

65

Сполуки винаходу можуть також бути змішані з одним або більше інсектицидами, фунгіцидами, бактерицидами, аттрактантами акарицидів або феромонами або іншими сполуками з біологічною дією. Тому отримані суміші мають розширений спектр діяльності. Суміші з іншими фунгіцидами особливо вигідні.

Фунгіцидні композиції даного винаходу можуть використовуватися для боротьби або попередження фітопатогенних грибів сільськогосподарських культур. Тому, згідно подальшого аспекту, даний винахід представляє спосіб боротьби або попередження фітопатогенних грибів сільськогосподарських культур, що відрізняється тим, що фунгіцидна композиція як зазначено вище, застосовується до зерна, рослини та/або до плоду рослини, або до землі, в якій рослина росте, або в якій бажають її виростити.

Композиція, яка використовується проти фітопатогенних грибів сільськогосподарських культур, містить ефективну та не-фітотоксичну кількість активної речовини загальної формули (I).

Вираз "ефективна та не-фітотоксична кількість" означає кількість композиції згідно винаходу, яка достатня, для боротьби або знищення грибів, присутніх або схильних до появи на сільськогосподарських культурах, та яка не спричиняє за собою ніякого відчутного симптому фітотоксичності до вищевказаних сільськогосподарських культур. Така кількість може змінюватися в широких межах залежно від гриба, з яким борються, виду сільськогосподарської культури, кліматичних умов та сполук, що входять у фунгіцидну композицію згідно винаходу.

Ця кількість може бути визначення систематичними випробуваннями при експлуатації, в межах здібностей спеціаліста, досвідченого в даній області.

Метод оброблення згідно даного винаходу є корисним, для оброблення матеріалу розмноження, як наприклад бульби або кореневища, але так же зерна, саджанців або розсади, та рослини або розсади рослин. Цей метод оброблення може бути також корисним, для оброблення коренів. Метод оброблення згідно даного винаходу може бути також корисним для оброблення надземних частин рослини, як наприклад стовбурів дерев, стовбурів рослин або стеблі, листя, квіток та плодів зацікавленої рослини.

Серед рослин, які можуть захищатися методом згідно винаходу, можна згадати - бавовник; льон; виноградну лозу; фруктові урожаї, як наприклад Rosaceae sp. (для прикладу - насінневі плоді, як наприклад яблука та груші, але так же і кісточкові плоди, як наприклад абрикоси, мигдалі та персики), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (для прикладу - дерев банана та насаджень), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (для прикладу - лимони, апельсини та грейпфрути); бобові культури, як наприклад Solanaceae sp. (для прикладу - помідори), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (для прикладу - салати), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp., Papilionaceae sp. (для прикладу - горох), Rosaceae sp. (для прикладу - полуниця); сільськогосподарські культури, як наприклад Graminae sp. (для прикладу - маїс, злаки як наприклад пшениця, рис, ячмінь та тритикале), Asteraceae sp. (для прикладу - соняшник), Cruciferae sp. (для прикладу - рапс), Papilionaceae sp. (для прикладу - соя), Solanaceae sp. (для прикладу - картопля), Chenopodiaceae sp. (для прикладу - буряк); садові та лісові культури; також як і генетично змінні гомологи цих культур.

Серед рослин і можливих хвороб цих рослин, захищених способом згідно даного винаходу, можна згадати:

- пшеницю, відносно боротьби з наступними хворобами зерна: фузаріоз (*Microdochium nivale* та *Fusarium roseum*), тверда (мокра) сажка пшениці (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* або *Tilletia indica*), септоріоз (*Septoria nodorum*) та вільна сажка;

- пшеницю, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин рослини: очкова плямистість злаків (*Tapesia yallundae*, *Tapesia acuiformis*), випрівання (*Gaeumannomyces graminis*), плямистість кореневого чохла (*F. culmorum*, *F. graminearum*), чорна короста (*Rhizoctonia cerealis*), справжня борошніста роса (*Erysiphe graminis forma speciei tritici*), іржа (*Puccinia striiformis* та *Puccinia recondita*) та септоріоз (*Septoria tritici* та *Septoria nodorum*);

- пшеницю та ячмінь, відносно боротьби з бактеріальними та вірусними хворобами, наприклад жовта мозаїка ячменю;

- ячмінь, відносно боротьби з наступними хворобами зерна: сітчаста плямистість (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* та *Cochliobolus sativus*), вільна сажка (*Ustilago nuda*) та фузаріоз (*Microdochium nivale* та *Fusarium roseum*);

- ячмінь, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин рослини: очкова плямистість злаків (*Tapesia yallundae*), сітчаста плямистість ячменю (*Pyrenophora teres* та *Cochliobolus sativus*), справжня борошніста роса (*Erysiphe graminis forma speciei hordei*), карликова листова (бура) іржа (*Puccinia hordei*) та плямистість листів (*Rhynchosporium secalis*);

- картоплю, відносно боротьби з наступними хворобами бульби (зокрема *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), мілдью (*Phytophthora infestans*) та певних вірусів (вірус Y);

- картоплю, відносно боротьби з наступними хворобами листя: бура плямистість (*Alternaria solani*), мілдью (*Phytophthora infestans*);

- бавовник, відносно боротьби з наступними хворобами молодих рослин, вирощених із насіння: випрівання (чорна ніжка) та гниль кореневого чохла (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*) та чорна коренева гниль (*Thielaviopsis basicola*);

- протеїнові культури, наприклад горох, відносно боротьби з наступними хворобами зерна: антракноз (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), фузаріоз (*Fusarium oxysporum*), сіра гниль (*Botrytis cinerea*) та мілдью (*Peronospora pisi*);

- оліє-вмісні культури, наприклад рапс, відносно боротьби з наступними хворобами насіння: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* та *Sclerotinia sclerotiorum*;

- кукурудзу, відносно боротьби з наступними хворобами зерна: (*Rhizopus* sp., *Penicillium* sp., *Trichoderma* sp., *Aspergillus* sp., та *Gibberellafitijkiroi*);

- льон, відносно боротьби з наступними хворобами насіння: *Alternaria linicola*;
- лісові дерева, відносно боротьби з випріванням (чорна ніжка) (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);
- рис, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин: пірикуляріоз (*Magnaporthe grisea*),
5 плямистість облямованої піхви (*Rhizoctonia solani*);
- бобові культури, відносно боротьби з наступними хворобами зерен або молодих рослин, вирощених з зерен: випрівання (чорна ніжка) та гниль кореневого чохла (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium* sp.);

- бобові культури, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин: сіра гниль (*Botrytis* sp.),
10 справжня борошніста роса (зокрема *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* та *Leveillula taurica*), фузаріоз (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), плямистість листів (*Cladosporium* sp.), альтернاریозна плямистість листів (*Alternaria* sp.), антракноз (*Colletotrichum* sp.), септоріозна плямистість листів (*Septoria* sp.) *septoria*, чорна короста (*Rhizoctonia solani*), мілдью (наприклад *Bremia lactucae*, *Peronospora* sp., *Pseudoperonospora* sp., *Phytophthora* sp.);

15 - фруктові дерева, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин: моніліоз (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), парша (*Venturia inaequalis*), справжня борошніста роса (*Podosphaera leucotricha*);

- виноградну лозу, відносно хвороби листя: зокрема сіра гниль (*Botrytis cinerea*), справжня борошніста роса (*Uncinula necator*), чорна гниль (*Guignardia biwella*) та мілдью (*Plasmopara viticola*);

20 - буряки, відносно боротьби з наступними хворобами надземних частин: захворювання церкоспора (*Cercospora beticola*), справжня борошніста роса (*Erysiphe beticola*), плямистість листів (*Ramularia beticola*).

25 Фунгіцидна композиція згідно даного винаходу може також використовуватися проти грибкових хвороб, схильних до виникнення на або усередині деревини. Термін "деревина" означає всі типи різновидів лісу, та всі види обробки цього лісу, що призначені для спорудження, наприклад тверда деревина, деревина з високою густиною, шарувата деревина та фанера. Метод оброблення деревини згідно винаходу переважно, полягає у контактуванні однієї або більше сполук даного винаходу, або композиції згідно винаходу; це включає наприклад безпосереднє застосування, розпорощення, занурення, вприскування або будь-які інші відповідні засоби.

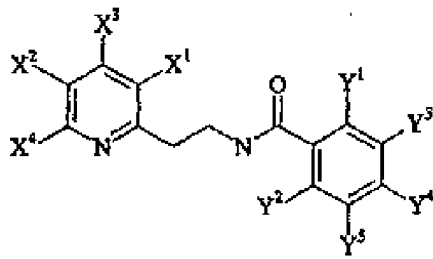
30 Доза активної речовини, що звичайно використовують при обробленні згідно даного винаходу, взагалі та переважно, становить між 10 та 800г/га, краще між 50 та 300г/га для використання при листяному обробленні. Доза активної використаної субстанції, взагалі та переважно, становить між 2 та 200г на 100кг зерна (насіння), краще між 3 та 150г на 100кг зерна (насіння) у разі оброблення зерна. Зрозуміло, що дози, вказані вище, надані як ілюстративні приклади винаходу. Спеціаліст у даній області техніки знатиме, як пристосувати вказані дози згідно виду сільськогосподарської культури, яка обробляється.

35 Фунгіцидна композиція згідно даного винаходу може також використовуватися при обробленні генетично змінених організмів сполуками згідно винаходу або агрохімічними композиціями згідно винаходу. Генетично змінені рослини - це рослини, в чий геном був стійко вбудований гетерологічний ген, який кодує білок, що нас цікавить. По суті "гетерологічний ген, який кодує білок, що нас цікавить", означає гени, які надають трансформованій рослині нові агрономічні властивості, або гени, що поліпшують агрономічні якості трансформованої рослини.

40 Композиції згідно даного винаходу можуть також використовуватися для підготовки композиції, корисної для лікування або попередження грибкових хвороб у людей та тварин, як наприклад, мікози, кожні захворювання (дерматози), стригучий лишай (трихофітія), кандидамікоз та кандидоз або хвороби, викликані *Aspergillus* spp., наприклад *Aspergillus fumigatus*.

45 Аспекти даного винаходу будуть зараз ілюстровані з посиланням на наступні таблиці сполук та прикладів. Наступні Таблиці А та В ілюструють необмежуваним чином приклади фунгіцидних сполук згідно даного винаходу. В наступних Прикладах, М+1 означає молекулярний іонний пік, плюс або мінус 1 а.м.у. (атомні масові одиниці) відповідно, який спостерігається в маспектроскопії та М (Arcl+) означає молекулярний іонний пік, оскільки це було знайдено за допомогою надлишкового атмосферного тиску при хімічній іонізації в маспектроскопії.

Таблиця А



Сполуки №	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	Y ⁵	M+1
A-1	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	H	H	363
A-2	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	H	363
A-3	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	Cl	Cl	397
A-4	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	H	H	347
A-5	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	F	H	365
A-6	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	Cl	H	397
A-7	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	H	359
A-8	Cl	CF ₃	H	H	OMe	OMe	H	H	H	389
A-9	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	343
A-10	Cl	CF ₃	H	H	H	H	F	H	H	347
A-11	Cl	CF ₃	H	H	H	H	Cl	H	H	363
A-12	Cl	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	H	359
A-13	Cl	CF ₃	H	H	H	H	OMe	OMe	H	389

U A 7 8 3 6 1 C 2

U A 7 8 3 6 1 C 2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-14	Cl	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	OMe	389
A-15	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	F	H	347
A-16	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	OMe	H	359
A-17	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	OBu	H	401
A-18	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	C(CH ₃) ₃	H	397
A-19	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	Me	H	343
A-20	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	H	H	397
A-21	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	Et	H	357
A-22	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	Pr	H	371
A-23	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	Bu	H	385
A-24	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	C ₃ H ₁₁	H	399
A-25	Cl	CF ₃	H	H	F	F	H	H	H	365
A-26	Cl	CF ₃	H	H	H	H	Me	H	H	343
A-27	Cl	CF ₃	H	H	H	H	CH ₂ Cl	H	H	377
A-28	Cl	CF ₃	H	H	H	H	CF ₃	H	H	397
A-29	Cl	CF ₃	H	H	NO ₂	H	H	H	H	374
A-30	Cl	CF ₃	H	H	H	H	NO ₂	H	H	374
A-31	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	NO ₂	H	374
A-32	Cl	CF ₃	H	H	H	H	Cl	H	Cl	396
A-33	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	H	F	365
A-34	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	F	F	365

UN
78361
C2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-35	Cl	CF ₃	H	H	H	H	F	H	F	365
A-36	Cl	CF ₃	H	H	H	H	CN	H	H	354
A-37	Cl	CF ₃	H	H	Me	Me	H	Me	H	371
A-38	Cl	CF ₃	H	H	H	H	NO ₂	Me	H	388
A-39	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	CO ₂ Me	H	387
A-40	Cl	CF ₃	H	H	F	F	F	H	H	383
A-41	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	F	F	383
A-42	Cl	CF ₃	H	H	F	F	H	F	H	383
A-43	Cl	CF ₃	H	H	F	H	F	F	F	401
A-44	Cl	CF ₃	H	H	F	Cl	H	H	H	382
A-45	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	H	H	455
A-46	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	H	407
A-47	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	F	H	H	413
A-48	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	Cl	H	H	397
A-49	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	Cl	397
A-50	Cl	CF ₃	H	H	NHCH ₃	H	H	H	H	358
A-51	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	OMe	H	H	389
A-52	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	H	H	345
A-53	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	Me	H	H	359
A-54	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	Cl	H	379
A-55	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	OMe	H	375
A-56	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	Me	H	359

UA 78361 C2

U A 7 8 3 6 1 C 2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-57	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	H	F	363
A-58	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	H	OMe	375
A-59	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	H	Me	359
A-60	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	Me	H	H	357
A-61	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	Me	H	357
A-62	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	Me	357
A-63	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	Cl	H	H	379
A-64	Cl	CF ₃	H	H	F	H	Cl	H	H	381
A-65	Cl	CF ₃	H	H	OH	F	H	H	H	363
A-66	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	Cl	H	H	377
A-67	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	F	H	H	361
A-68	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	F	H	363
A-69	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	H	Cl	381
A-70	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	OH	H	H	359
A-71	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	OMe	436
A-72	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	H	CF ₃	465
A-73	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	F	H	415
A-74	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	465
A-75	Cl	CF ₃	H	H	F	CF ₃	Cl	H	H	449
A-76	Cl	CF ₃	H	H	PhCH ₂	H	H	H	H	419
A-77	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	NO ₂	H	H	388
A-78	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	NO ₂	H	NO ₂	433

U A 7 8 3 6 1 C 2

U A 7 8 3 6 1 C 2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-79	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	NO ₂	388
A-80	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	Br	H	421
A-81	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	OMe	H	H	373
A-82	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	OMe	OMe	H	419
A-83	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	OMe	H	389
A-84	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	OMe	OMe	419
A-85	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	OMe	389
A-86	Cl	CF ₃	H	H	OEt	H	H	H	H	373
A-87	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	Cl	H	393
A-88	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	Cl	393
A-89	Cl	CF ₃	H	H	OCF ₃	H	H	H	H	413
A-90	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	F	377
A-91	Cl	CF ₃	H	H	OPr	H	H	H	H	387
A-92	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	t-Bu	415
A-93	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	Br	441
A-94	Cl	CF ₃	H	H	I	H	I	H	I	397
A-95	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	NO ₂	H	H	408
A-96	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	NO ₂	H	408
A-97	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	NO ₂	408
A-98	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	SO ₂ F	445
A-99	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	SMe	409
A-100	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	Cl	441

U A 7 8 3 6 1 C 2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-101	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	NO ₂	H	Cl	442
A-102	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	Br	485
A-103	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	Cl	H	Cl	431
A-104	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	CF ₃	431
A-105	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	NO ₂	H	H	452
A-106	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	Cl	F	415
A-107	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	F	F	399
A-108	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	OMe	OMe	H	423
A-109	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	NO ₂	452
A-110	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	Cl	H	441
A-111	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	Cl	H	H	441
A-112	Cl	CF ₃	H	H	F	Br	H	H	H	425
A-113	Cl	CF ₃	H	H	Cl	F	F	H	H	399
A-114	Cl	CF ₃	H	H	Et	H	H	H	H	357
A-115	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	Me	CO ₂ Et	429
A-116	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	Me	H	Cl	391
A-117	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	F	H	361
A-118	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	Cl	F	H	395
A-119	Cl	CF ₃	H	H	O-CF ₂ - CHFCI	H	H	Cl	H	495
A-120	Cl	CF ₃	H	H	O-anln	H	H	Cl	H	419
A-121	Cl	CF ₃	H	H	O-anln	H	H	H	H	385

U A 7 8 3 6 1 C 2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-122	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	F	H	H	425
A-123	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	Me	F	Me	409
A-124	Cl	CF ₃	H	H	Cl	F	Me	H	H	395
A-125	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	F	Cl	H	415
A-126	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	CF ₃	H	431
A-127	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	H	Cl	H	409
A-128	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	H	Cl	H	441
A-129	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	NO ₂	H	452
A-130	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	SO ₂ Me	H	441
A-131	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	CN	H	388
A-132	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	Cl	Cl	H	431
A-133	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	H	Br	H	485
A-134	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	Me	421
A-135	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	SO ₂ NMe ₂	H	504
A-136	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	OH	SO ₂ Me	H	457
A-137	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	SO ₂ Me	H	485
A-138	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	475
A-139	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	H	CF ₃	H	475
A-140	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	H	F	H	393
A-141	Cl	CF ₃	H	H	H	H	Br	Cl	H	441
A-142	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	SMe	H	389
A-143	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	H	CF ₃	H	443

U A 7 8 3 6 1 C 2

UN 78361 C2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

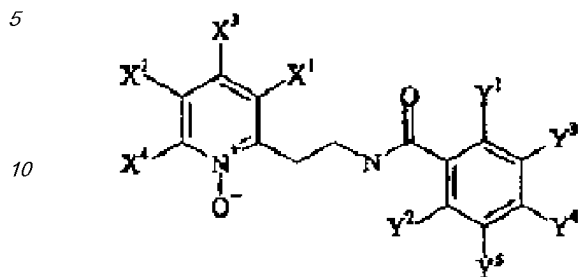
A-144	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	Cl	Cl	H	443
A-145	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	SMe	H	409
A-146	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	Br	Cl	H	487
A-147	Cl	CF ₃	H	H	H	H	CF ₃	Cl	H	431
A-148	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	OMe	F	H	423
A-149	Cl	CF ₃	H	H	F	H	OMe	F	H	395
A-150	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	SMe	H	453
A-151	Cl	CF ₃	H	H	iPr	H	Br	H	H	449
A-152	Cl	CF ₃	H	H	Et	H	H	Br	H	435
A-153	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	H	Br	H	453
A-154	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	OMe	Br	H	515
A-155	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	F	Cl	H	459
A-156	Cl	CF ₃	H	H	NO ₂	H	H	Me	Me	402
A-157	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	O-CH ₂ -CF ₂	Br	H	533
A-158	Cl	CF ₃	H	H	H	H	Br	I	H	533
A-159	Cl	CF ₃	H	H	F	H	SO ₂ NMe ₂	F	H	472
A-160	Cl	CF ₃	H	H	H	H	NO ₂	Me	Me	402
A-161	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	SO ₂ Me	H	425
A-162	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	F	Cl	H	395
A-163	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	F	CF ₃	H	493
A-164	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	OCF ₃	491

UA 78361 C2

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

A-165	Cl	CF ₃	H	H	F	H	SMe	F	H	411
A-166	Cl	CF ₃	H	H	CHCH ₂	H	H	F	H	373
A-167	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	H	H	H	375
A-168	Cl	CF ₃	H	H	F	H	SMe	Br	H	471
A-169	Cl	CF ₃	H	H	H	H	I	OH	I	597
A-170	Cl	CF ₃	H	H	CN	H	H	H	H	354
A-171	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	NO ₂	H	404
A-172	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	H	F	415
A-173	Cl	CF ₃	H	H	F	CF ₃	H	H	H	415
A-174	Cl	CF ₃	H	H	F	I	H	H	H	473
A-175	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	F	425
A-176	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	Cl	H	489
A-177	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	H	Me	469
A-178	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	Me	H	H	377
A-179	Cl	CF ₃	H	H	I	H	Me	H	H	469
A-180	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	Me	H	H	421
A-181	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	OMe	OMe	423
A-182	Cl	CF ₃	H	H	F	Cl	Me	H	H	395
A-183	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	H	Br	533
A-184	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	Me	377
A-185	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	H	I	489
A-186	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	F	361
A-187	Cl	CF ₃	H	H	OCHF ₂	H	H	H	H	395
A-188	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	H	Cl	489
A-189	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	OMe	OMe	515
A-190	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	F	H	425
A-191	Cl	CF ₃	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	422
A-192	Cl	CF ₃	H	H	S-CHF ₂	H	H	H	H	411
A-193	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	NH ₂	H	H	358
A-194	Cl	CF ₃	H	H	NH ₂	H	Me	H	H	358
A-195	Cl	CF ₃	H	H	iPr	H	H	H	H	371
A-196	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	CF ₃	H	397

Таблиця В



15

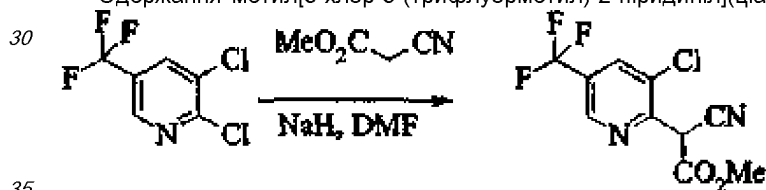
Сполуки №	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	Y ⁵	M+H
В-1	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	H	H	H	413
В-2	Cl	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	H	375
В-3	Cl	CF ₃	H	H	F	F	H	H	H	381
В-4	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	H	359
В-5	Cl	CF ₃	H	H	F	Cl	H	H	H	398

20

25

Наступні приклади одержання сполук надані з метою ілюстрації винаходу, але їх не потрібно розглядати, як обмеження даного винаходу.

Одержання метил[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл](ціан)ацетату:

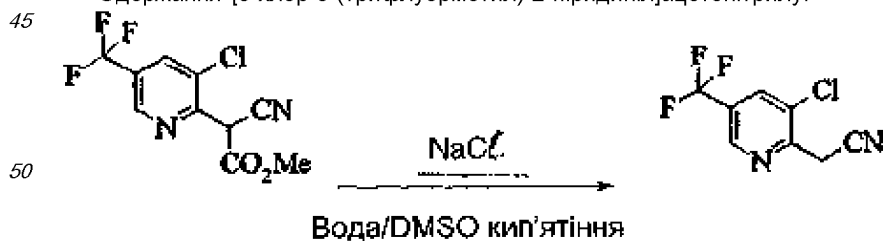


Методика:

В атмосфері аргону 116г гідриду натрію, 60% дисперсія в маслі (2,91моль, 1,8екв.), суспендують в 3л ДМФА. Суспензію охолоджують у водяній бані зі льодом. 160г (1,616моль, 1,0екв.) метилціанацетату в розчині 200мл ДМФА додають по краплинам при перемішуванні. Як тільки весь газ виділиться, додають по краплинам при перемішуванні 350г (1,616моль, 1,0екв.) 2,3-дихлор-5-(трифлуорметил)піридину. Суміш перемішують всю ніч при температурі навколишнього середовища. Додають 50мл метанолу. Реакційну суміш виливають у 5л води. pH доводять до 3-4 концентрованою соляною кислотою. Жовтий осад метил[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл](ціан)ацетату фільтрують та промивають водою та пентаном.

40

Одержання [3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]ацетонітрилу:



Методика:

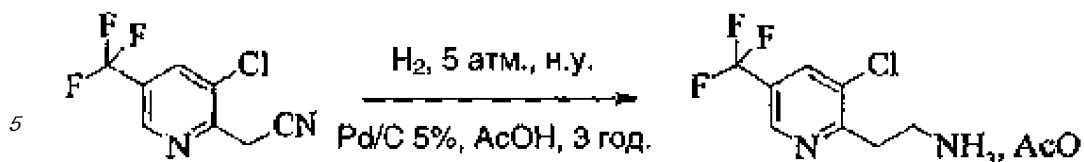
314г (1,13моль, 1екв.) метил[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл](ціан)ацетату та 22г (0,38моль, 0,33екв.) хлориду натрію розчинюють в розчині 44мл води та 1,1л диметилсульфоксиду. Реакційну суміш перемішують та нагрівають до 160°C. Як тільки весь газ виділиться, розчин охолоджують до температури навколишнього середовища. Додають 1л води та 0,5л дихлорметану. Після розділення, водну фазу екстрагують двічі 0,5л дихлорметану. Органічну фазу промивають двічі 0,5л води та сушать сульфатом магнію. Після випаровування, сирий продукт розбавляють 100мл дихлорметану та елюють етилацетат/гептан сумішшю (20/80) на пластинці з силікагелю. Фільтрат випарюють до суха, щоб одержати [3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]ацетонітрил.

55

60

Одержання 2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етанамін ацетату:

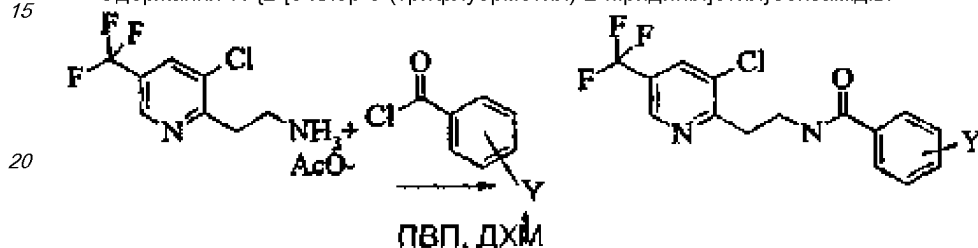
65



Методика:

10 113г [3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]ацетонітрилу (0,51моль, 1екв.) розчиняють у 2,5л оцтової кислоти. Додають 30г паладію (5% на деревному вугіллі). Реакційну суміш перемішують при температурі навколишнього середовища під тиском водню 5атм. Проходження реакції спостерігають за допомогою ТШХ; коли [3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]ацетонітрил буде цілком використаний, реакційну суміш фільтрують через целіт, а потім випарюють до суха, щоб одержати 2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етанамін ацетату.

15 Одержання N-[2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил]бензамідів:



Методика:

25 0,100г 2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етанамін ацетату (0,00037моль, 1,0екв.) розчиняють в 3мл дихлорметану. Додають 0,500г полі(4-вінілпіридину). Суміш перемішують при температурі навколишнього середовища півгодини. Додають 1,2 еквіваленти бажаного ацилхлориду. Реакційну суміш перемішують при температурі навколишнього середовища цілу ніч, потім фільтрують та випарюють до суха. Сирий продукт потім очищають зворотною фазою ВЕРХ. Відповідний амід таким чином отримують.

30 Наступні біологічні тести були проведені для того, щоб порівняти активність сполук загальної формули (I) згідно даного винаходу та сполук, описаних в заявці на патент WO 01/11965, щодо певної кількості фунгіцидних захворювань.

Випробування *in vivo* активності на *Alternaria brassicae* (чорна плямистість хрестоцвітів)

35 Водний розчин активної речовини, що досліджується, готують з концентрацією 2г/л розтиранням у розчині 1 або розчині 2:

Розчин 1

- Вода

- Tween 80 розбавляють до 10% водою: 5мкл/мг активної речовини

- Глина в достатній кількості для активної речовини + глина, щоб дорівнювати 100мг;

40 Розчин 2

Сконцентрований розчин, що містить поверхнево-активні речовини та загальноприйняті ад'юванти: 200мкл/мг активної речовини.

Водний розчин розбавляють так водою, щоб отримати бажану концентрацію.

Редиски сорту Pernet засівають у 50/50 пуццолан/торф субстраті та підтримують температуру 18-22°C.

45 Оброблення здійснюють за допомогою обприскування водною суспензією. Контрольні необроблені рослини обприскують водою.

Через 24 години після оброблення, рослини інокують за допомогою обприскування розчином спор *Alternaria brassicae* (40000спор/мл), що походять від 12-денної культури.

50 Паростки редиски потім витримують при 18-20°C у вологій атмосфері. Ефективність продукції оцінюється щодо контрольних рослин після семи - восьми днів інкубації.

Випробування *in vivo* активності на *Botrytis cinerea* на огірку Водний розчин активної речовини, що досліджується, готують з концентрацією 2г/л розтиранням у розчині 1 або розчині 2:

Розчин 1

- Вода

55 - Tween 80 розбавляють до 10% водою: 5мкл/мг активної речовини

- Глина в достатній кількості для активної речовини + глина, щоб дорівнювати 100мг;

Розчин 2

Сконцентрований розчин, що містить поверхнево-активні речовини та загальноприйняті ад'юванти: 200мкл/мг активної речовини.

60 Водний розчин розбавляють так водою, щоб отримати бажану концентрацію.

Огірки сорту Marketer засівають у 50/50 пуццолан/торф субстраті та підтримуються температуру 18-22 °C.

Оброблення здійснюють за допомогою обприскування водною суспензією. Контрольні необроблені рослини обприскують водою.

65 Через 24 години після оброблення, рослини інокують за допомогою обприскування розчином спор *Botrytis cinerea* (150000спор/мл), що походять від 15-денної культури.

Паростки огірка потім витримують при 11-15°C у вологій атмосфері. Ефективність продукції оцінюється щодо контрольних рослин після семи - восьми днів інкубації.

Випробування *in vivo* активності на *Pyrenophora teres* (сітчаста плямистість ячменю)

Водний розчин активної речовини, що досліджується, готують з концентрацією 2г/л розтиранням у розчині 1 або розчині 2:

Розчин 1

- Вода I

- Tween 80 розбавляють до 10% водою: 5мл/мг активної речовини

- Глина в достатній кількості для активної речовини + глина, щоб дорівнювати 100мг;

Розчин 2

Сконцентрований розчин, що містить поверхнево-активні речовини та загальноприйняті ад'юванти: 200мл/мг активної речовини.

Водний розчин розбавляють так водою, щоб отримати бажану концентрацію.

Рослини ячменю сорту Express засівають у 50/50 пуццолан/торф субстрат та підтримуються температуру 12°C. Оброблення здійснюють на 1-листовій відстані (10см) за допомогою обприскування водною суспензією. Контрольні необроблені рослини обприскують водою.

Через 24 години після оброблення, рослини інокують за допомогою обприскування розчином спор *Pyrenophora teres* (10000спор/мл), що походять від 10-денної культури.

Паростки ячменю потім витримують при 18°C у вологій атмосфері. Ефективність продукції оцінюється щодо контрольних рослин після восьми-п'ятнадцяти днів інкубації.

Випробування *in vivo* активності на *Septoria tritici* (септоріоз пшениці) Водний розчин активної речовини, що досліджується, готують з концентрацією 2 г/л розтиранням у розчині 1 або розчині 2:

Розчин 1

- Вода

- Tween 80 розбавляють до 10% водою: 5мл/мг активної речовини

- Глина в достатній кількості для активної речовини + глина, щоб дорівнювати 100мг;

Розчин 2

Сконцентрований розчин, що містить поверхнево-активні речовини та загальноприйняті ад'юванти: 200мл/мг активної речовини.

Водний розчин розбавляють так водою, щоб отримати бажану концентрацію.

Рослини пшениці сорту Scipion засівають у 50/50 пуццолан/торф субстрат та підтримуються температуру 12°C. Оброблення здійснюють на 1-листовій відстані (10см) за допомогою обприскування водною суспензією. Контрольні необроблені рослини обприскують водою.

Через 24 години після оброблення, рослини інокують за допомогою обприскування розчином спор *Septoria tritici* (500 000спор/мл) від 7-денної культури.

Паростки пшениці потім витримують при 18-20°C у вологій атмосфері протягом 72 годин, а потім при відносній вологості 90%. Ефективність продукції оцінюється щодо контрольних рослин після 21-28 днів зараження.

Ефективність сполук оцінена при 500г/га, 250г/га або 330част./млн. відносно контрольних необроблених рослин. При цих умовах хороша ефективність визначена як більш ніж 80% ефективності. Середня ефективність визначена як ефективність між 50 та 80%. Низька ефективність визначена як ефективність між 10 та 50% та нульова ефективність визначена як менш ніж 10% ефективності.

При концентрації 500г/га, наступні сполуки, показують середню ефективність проти патогенних грибів:

Alternaria brassicae: A-2, A-4, A-6, A-7, A-9, A-13, A-14, A-20, A-25.

Botrytis cinerea: A-2, A-7, A-9, A-20, A-25.

Pyrenophora teres: A-2, A-4, A-5, A-6, A-7, A-9, A-20, A-25, A-27.

Septoria tritici: A-2, A-4, A-5, A-6, A-7, A-16, A-18, A-20, A-21, A-22, A-23, A-24, A-25.

При концентрації 250г/га, наступні сполуки, показують середню ефективність проти патогенних грибів:

Alternaria brassicae: A-20, A-28, A-29, A-41, A-45, A-46, A-73, A-173.

Botrytis cinerea: A-20, A-45, A-46, A-73.

Pyrenophora teres: A-20, A-45, A-46, A-73.

При концентрації 330част./млн., наступні сполуки, показують середню ефективність проти патогенних грибів:

Alternaria brassicae : A-20, A-44, A-45, A-46, A-47, A-48, A-49, A-52, A-60, A-61, A-62, A-71, A-72, A-73, A-74, A-75, A-76, A-77, A-79, A-80, A-83, A-84, A-85, A-86, A-87, A-89, A-91, A-92, A-96, A-98, A-99, A-100, A-107, A-110, A-112, A-113, A-417, A-122, A-123, A-124, A-125, A-127, A-128, A-133, A-134, A-135, A-136, A-137, A-138, A-139, A-140, A-141, A-142, A-143, A-144, A-146, A-147, A-148, A-150, A-151, A-152, A-156, A-157, A-158, A-159, A-162, A-165, A-166, A-167, A-168, A-169, A-170, A-171, A-173, A-174, A-175, A-176, A-177, A-178, A-179, A-180, A-181, A-182, A-183, A-184, A-185, A-186, A-187, A-188, A-189, A-194, B-1.

Botrytis cinerea: A-20, A-45, A-46, A-73, A-170, A-172, A-173, A-174, A-175, A-187.

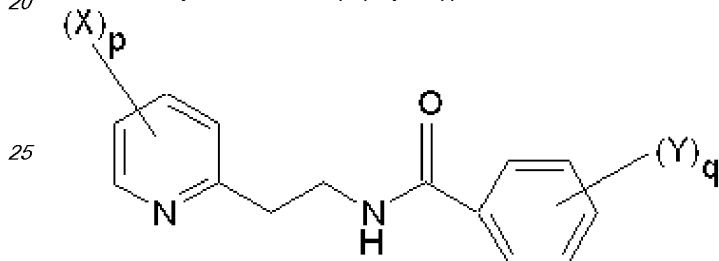
Pyrenophora teres: A-20, A-44, A-46, A-61, A-73, A-83, A-87, A-89, A-96, A-117, A-125, A-133, A-134, A-140, A-167, A-173, A-174, A-187, B-1.

При цих умовах, N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2,6-дихлорбензамід показує відповідно низьку та нульову ефективність на *Alternaria Brassicae* при 330част./млн. та 250г/га; та нульову ефективність на *Botrytis cinerea* при 250г/га та 330част./млн.

При цих умовах, N-{1-метилкарбамот-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-4-фенілбензамід розкритий у заявці на патент WO 01/11965 (дивись сполуку 316 в Таблиці D) показує низьку ефективність на *Alternaria Brassicae* та *Septoria tritici*, та нульову ефективність на *Botrytis cinerea* при 250г/га; N-{1-етилкарбамоїл-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-3-нітробензамід також розкритий у заявці на патент WO 01/11965 (дивись сполуку 307 в Таблиці D) показує нульову ефективність на *Alternaria Brassicae* та *Botrytis cinerea* при 250г/га; N-{1-етилкарбамоїл-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}бензамід та N-{1-метилкарбамоїл-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}бензамід також розкриті у заявці на патент WO 01/11965 (дивись сполуки 304 та 314 в Таблиці D) показують низьку ефективність на *Septoria tritid* та нульову ефективність на *Botrytis cinerea* при 250г/га; та N-{1-етилкарбамот-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-4-хлорбензамід, N-{1-етилкарбамоїл-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-бромбензамід та N-{1-метилкарбамоїл-2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-4-метоксибензамід також розкриті у заявці на патент WO 01/11965 (дивись сполуки 306, 310 та 315 в Таблиці D) показують нульову ефективність на *Botrytis cinerea* при 250г/га.

Формула винаходу

1. Сполука загальної формули (I):



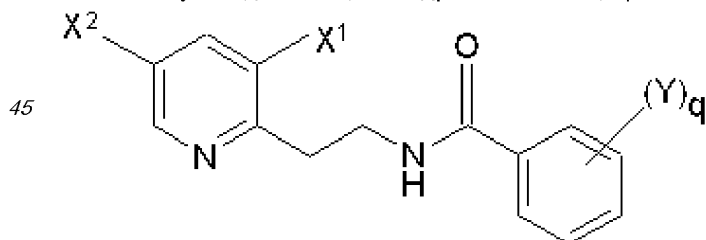
в якій:

- p - це ціле число та означає 1, 2, 3 або 4;
- q - це ціле число та означає 1, 2, 3, 4 або 5;
- кожен X незалежно вибраний з галогену, алкілу або галогеналкілу, та принаймні один X є галогеналкілом;
- кожен Y незалежно вибраний з галогену, алкілу, алкенілу, алкінілу, галогеналкілу, алкокси, аміно, фенокси, алкілію, діалкіламіно, ацилу, ціану, ефіру, гідрокси, аміноалкілу, бензили, галогеналкокси, галогенсульфонілу, галогентіоалкілу, алкоксилалкенілу, алкілсульфонаміду, нітро, алкілсульфонілу, фенілсульфонілу або бензилсульфонілу;

а також її N-оксиди 2-заміщеного піридину; за винятком N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2,6-дихлорбензаміду.

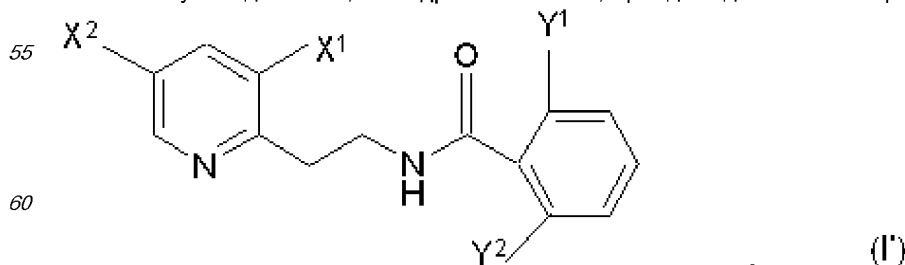
2. Сполука згідно з п.1, яка відрізняється тим, що p означає 2.

3. Сполука згідно з п. 2, яка відрізняється тим, що замісники X займають положення, як вказано нижче:



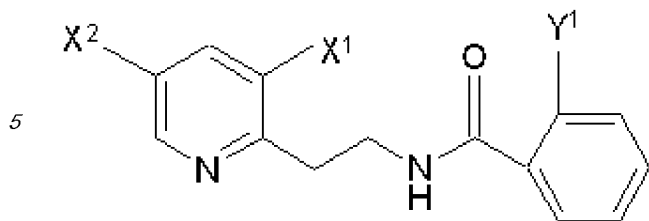
4. Сполука за будь-яким з пп. 1-3, яка відрізняється тим, що q означає 1 або 2, замісник(и) Y знаходи(я)ться в орто-положенні бензольного кільця.

5. Сполука згідно з п. 4, яка відрізняється тим, що відповідає загальній формулі (I'):



6. Сполука згідно з п. 5, яка відрізняється тим, що X¹ являє собою галоген та X² являє собою галогеналкіл.

7. Сполука згідно з п. 4, яка відрізняється тим, що відповідає загальній формулі (I''):



(I'')

8. Сполука згідно з п. 7, яка відрізняється тим, що має наступні особливості, узяті індивідуально або в комбінації:

- X¹ являє собою галоген та X² являє собою галогеналкіл;
- Y¹ являє собою галоген або галогеналкіл.

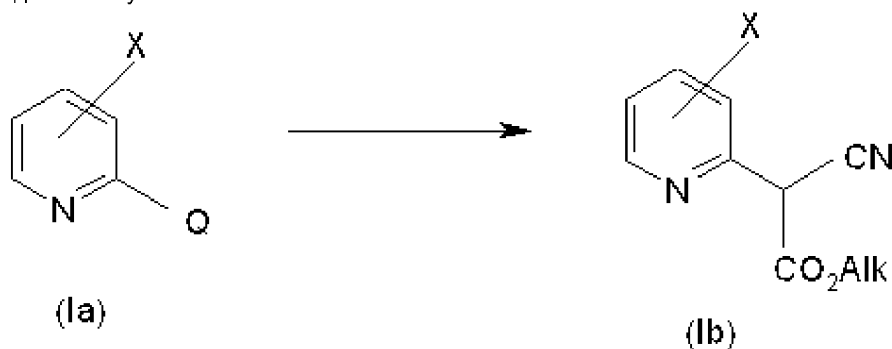
9. Сполука згідно з п. 8, яка відрізняється тим, що галогеналкіл являє собою трифлуорметил.

10. Сполука згідно з п. 9, яка відрізняється тим, що сполука формули (I'') являє собою:

- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-трифлуорметилбензамід;
- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-йодбензамід;
- N-{2-[3-хлор-5-(трифлуорметил)-2-піридиніл]етил}-2-бромбензамід.

11. Спосіб одержання сполук згідно з будь-яким з пунктів 1-10, який відрізняється тим, що включає такі стадії:
- на першій стадії здійснюють взаємодію, при наявності основи в апротонному полярному розчиннику, сполуки загальної формули (Ia) для того, щоб ввести вибірково замісник у 2-положення:

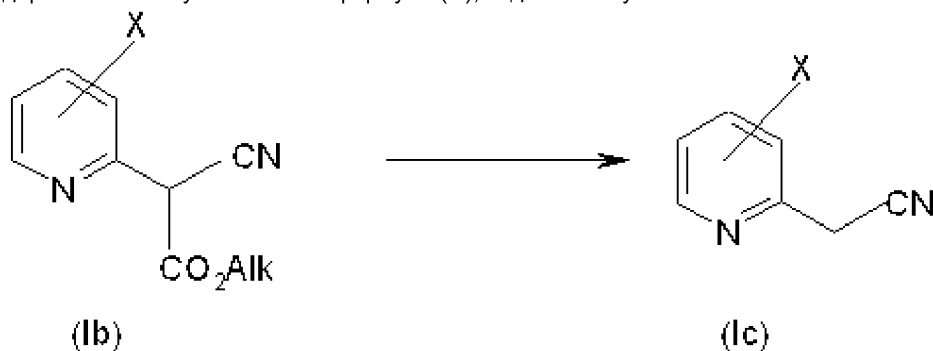
з будь-якою групою типу алкілціанацетату (NC-CH₂-CO₂Alk), з одержанням сполуки загальної формули (Ib) згідно з наступною схемою:



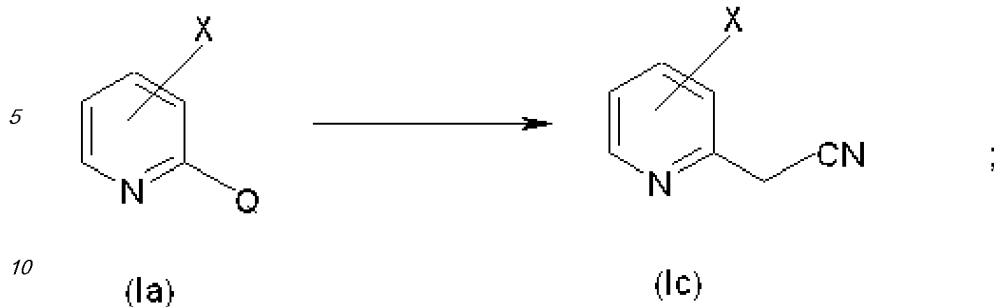
де:

- X визначений за будь-яким з пунктів 1-9;
- Alk означає радикал алкіл;
- Q - це нуклеофуг;

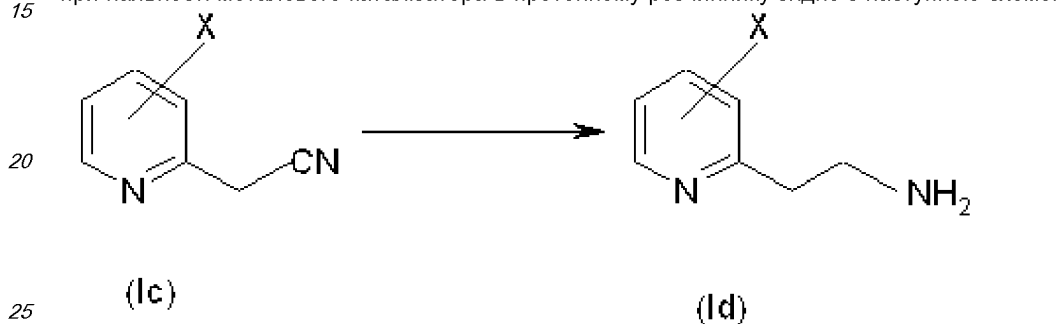
таким чином отриману сполуку загальної формули (Ib) потім піддають деалкілоксикарбонілюванню в присутності галогенідів лужних металів, як, наприклад, Li-галогенід, K-галогенід або Na-галогенід, при кип'ятінні із зворотним холодильником у водному/диметилсульфоксидному розчині, згідно з реакцією Крапчо, з одержанням сполуки загальної формули (Ic), згідно з наступною схемою:



або безпосередньо з ацетонітрилом, з одержанням сполуки загальної формули (Ic), згідно з наступною схемою:

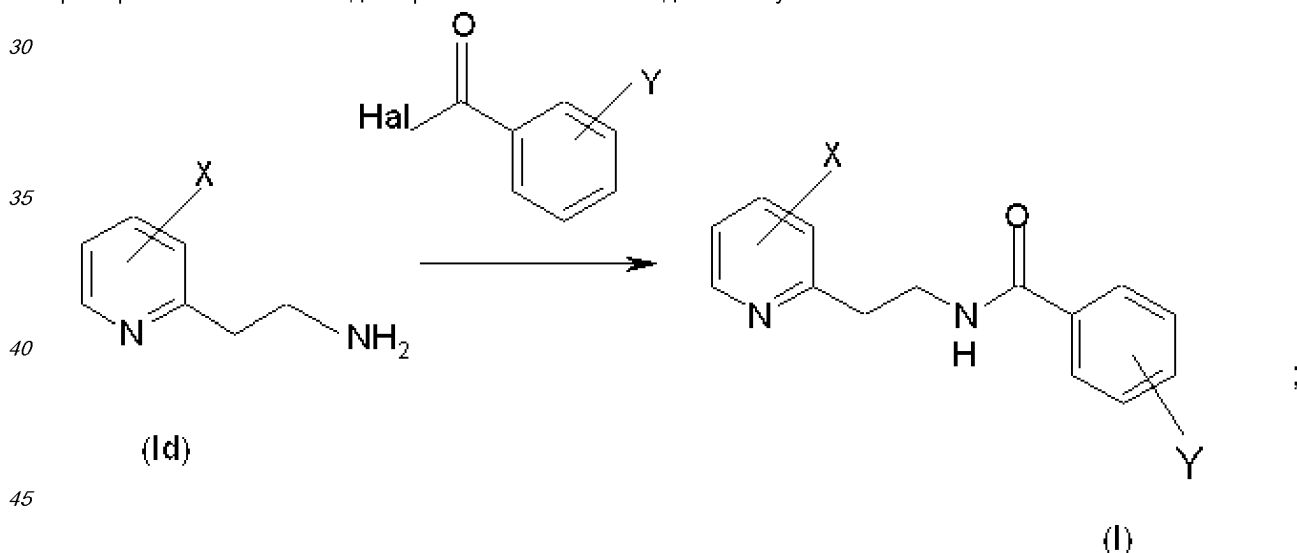


- на другій стадії здійснюють відновлення сполуки загальної формули (1c) до піридинетанаміну загальної формули (1d) або, відповідно, до його солі амонію, залежно від того, чи є середовище кислим, під тиском водню при наявності металевого каталізатора в протонному розчиннику згідно з наступною схемою:



або відповідна сіль амонію,

- на третій стадії здійснюють перетворення сполуки загальної формули (1d) у сполуку загальної формули (1) реакцією з бензоїлгалогенідом при наявності основи згідно з наступною схемою:



або відповідна сіль амонію,

де Y є визначеним за будь-яким з пп.1-9.

12. Спосіб згідно з п.11, який відрізняється тим, що нуклеофуг Q являє собою галоген або трифлуорметансульфонат.

13. Фунгіцидна композиція, що включає ефективну кількість сполуки згідно з будь-яким з пп.1-10 та сільськогосподарсько прийнятну основу.

14. Фунгіцидна композиція згідно п.13, що додатково включає поверхнево-активну речовину.

15. Фунгіцидна композиція за будь-яким з пп. 13 та 14, що включає від 0,05 до 99 мас. % активної речовини.

16. Спосіб попередження або боротьби з фітопатогенними грибами сільськогосподарських культур, який відрізняється тим, що ефективну та нефітотоксичну кількість композиції за будь-яким з пп.13-15 застосовують до зерна або до листів рослини, та/або до плодів рослини, або до землі, в якій рослина росте або в якій бажають її виростити.

Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2007, N 3, 15.03.2007. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і науки України.