



УКРАЇНА

(19) **UA**
(51) МПК(11) **123211**(13) **C2****C07C 257/18** (2006.01)**C07C 205/38** (2006.01)**C07C 217/90** (2006.01)**A01N 37/52** (2006.01)

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: **а 2018 00339**
(22) Дата подання заявки: **13.06.2016**
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: **04.03.2021**
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **15172107.3**
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **15.06.2015**
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: **EP**
(41) Публікація відомостей про заявку: **12.03.2018, Бюл.№ 5**
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: **03.03.2021, Бюл.№ 9**
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: **PCT/EP2016/063508, 13.06.2016**

(72) Винахідник(и):
**Хілленбранд Штефан (DE),
Ес-Сайєд Мазен (DE),
Вахендорфф-Нойманн Ульріке (DE),
Брене Стефан (FR)**
(73) Володілець (володільці):
**БАЄР КРОПСАЄНС
АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ,
Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am
Rhein, Germany (DE)**
(74) Представник:
**Пахаренко Олександр Володимирович,
реєстр. №136**
(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:
DATABASE REGISTRY, CHEMICAL
ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO,
US, 23 February 2014 (2014-02-23), Database
accession no. 1553272-71-1
DATABASE REGISTRY, CHEMICAL
ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO,
US, 17 February 2014 (2014-02-17), Database
accession no. 1547256-63-2
DATABASE REGISTRY, CHEMICAL
ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO,
US, 20 February 2014 (2014-02-20), Database
accession no. 1550451-16-5
DATABASE REGISTRY, CHEMICAL
ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO,
US, 19 February 2014 (2014-02-19), Database
accession no. 1549819-34-2
DATABASE REGISTRY, CHEMICAL
ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO,
US, 18 February 2014 (2014-02-18), Database
accession no. 1548485-38-6
WO 2008/110278 A2
WO 2008/110313 A1

UA 123211 C2**(54) ГАЛОГЕНЗАМІЩЕНІ ФЕНОКСИФЕНІЛАМІДИНИ ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ЯК ФУНГІЦИДІВ****(57) Реферат:**

Представлений винахід стосується галоген-заміщених феноксифеніламідинів загальної формули (I), способу їх отримання, застосування амідинів відповідно до винаходу для контролю за небажаними мікроорганізмами та також агрохімічної композиція для даної цілі, яка містить

галоген-заміщені феноксифеніламідини відповідно до винаходу. Крім того, винахід стосується способу для контролю за небажаними мікроорганізмами за рахунок застосування сполуки відповідно до винаходу до мікроорганізмів та/або їх середовища існування.

Представлений винахід стосується галоген-заміщених феноксифеніламідинів загальної формули (I), способу їх отримання, застосування амідинів відповідно до винаходу для контролю за небажаними мікроорганізмами та також композиції для даної цілі, яка містить галоген-заміщені феноксифеніламідини відповідно до винаходу. Крім того, винахід також стосується способу контролю за небажаними мікроорганізмами, який характеризується тим, що сполуки формули (I) застосовують до мікроорганізмів та/або в їх середовищі існування.

WO2000/046184 розкриває застосування амідинів, включаючи N-метил-N'-метил-N'-[(4-фенокси)-2,5-ксиліл]формамідин, як фунгіцидів.

WO2003/093224, WO2007/031512, WO2007/031513, WO2007/031523, WO2007/031524, WO2007/031526, WO2007/031527, WO2007/061966, WO2008/101682, WO2008/110279, WO2008/110280, WO2008/110281, WO2008/110312, WO2008/110313, WO2008/110314, WO2008/110315, WO2008/128639, WO2009/156098, WO2009/156074, WO2010/086118, WO2012/025450, WO2012/090969 та WO2014/157596 розкривають застосування ариламідинових похідних, як фунгіцидів.

WO2007/031508 та WO2007/093227 розкривають застосування ариламідинових похідних, як фунгіцидів та інсектицидів.

WO2003/024219 розкриває фунгіцидні композиції, які містять, щонайменше, одну N2-феніламідинову похідну в комбінації з додатковою вибраною відомою активною сполукою.

WO2004/037239 розкриває антифунгіцидні лікарські засоби на основі N2-феніламідинових похідних.

WO2005/089547, WO2005/120234, WO2012/146125, WO2013/136275, та WO2014/037314 розкривають фунгіцидні суміші, які містять, щонайменше, одну ариламідинову похідну та додатковий вибраний відомий фунгіцид.

WO2007/031507 розкриває фунгіцидні суміші, які містять, щонайменше, одну ариламідинову похідну та два інших вибраних відомих фунгіциди.

З WO2008/110278 відомо, що різні феніламідинові похідні демонструють фунгіцидні властивості. Крім того зазначається, що сполуки відповідно до формули (I), розкриті в WO2008/110278, мають виключні гербіцидні властивості. Гербіциди представляють собою речовини, які використовуються для контролю або усунення небажаних рослин (бур'янів), тобто вони, як правило, мають руйнівні властивості щодо рослин, які використовуються в сільському господарстві для знищення бур'янів на полях, на яких вирощують сільськогосподарські культури. Слід розрізняти селективні та неселективні гербіциди. Перші охоплюють сполуки, здатні знищувати конкретні цільові бур'яни, в той же час залишаючи бажану сільськогосподарську культуру відносно неушкодженою. На відміну від цього, коли їх застосовують, сполуки другого класу знищують весь рослинний матеріал. WO 2008/110278 зазначає, що сполуки відповідно до формули (I) з WO 2008/110278 мають селективну гербіцидну активність проти бур'янів, але залишають сільськогосподарські культури, такі як пшениця, ячмінь, жито, кукурудза, цукровий буряк, бавовник та соя, відносно непошкодженими. Однак, біологічні приклади, розкриті в WO2008/110278 швидше вказують на те, що певні сполуки відповідно до формули (I) з WO 2008/110278 до певної міри мають гербіцидні властивості проти деяких бур'янів (щонайменше 80 % гербіцидної активності оцінюється за видимими пошкодженнями оброблених рослин) без зазначення того, які сільськогосподарські культурні рослини (такі як ті рослини, які зазначені вище) були використані для доведення гербіцидної селективності, залишаючи оброблені сільськогосподарські культури незмінними. Крім того, швидкість пошкодження досліджуваних (але не зазначених) сільськогосподарських культур не була зазначеною. Крім того, відомо, що різні сорти певних сільськогосподарських культур демонструють різні рівні чутливості по відношенню до певної гербіцидно активної сполуки. Особливо приймаючи до уваги факт твердження WO2008/110278, про те, що зазначені вище сільськогосподарські культури не є або є тільки трохи пошкодженими після обробки сполуками відповідно до формули (I) з WO2008/110278 є швидше дуже загальними.

Висновок про гербіцидну селективність сполук, розкритих в WO 2008/110278 є сумнівним. Тому, потенційне пошкодження сільськогосподарських культур, спричинене сполуками з WO 2008/110278 є непередбаченим.

Ефективність амідинів, описаних у попередньому рівні техніки як фунгіцидів, є гарною, але в багатьох випадках залишає бажати кращого.

Відповідно, задачею представленого винаходу є забезпечити амідини, які мають покращену фунгіцидну ефективність, та покращити сумісність з рослинами.

Ще однією проблемою для розгляду при розробці нових та покращених феніламідинів, як фунгіцидів, є покращена хімічна стабільність таких сполук в порівнянні з відомими амідинами, наприклад, підвищена стійкість до гідролізу та/або фотолізу.

Як правило, гідроліз означає реакцію з водою. Він представляє собою хімічний процес, в якому один або декілька хімічних зв'язків у молекулі розщеплюються за рахунок додавання води. Іноді, дане додавання викликає розщеплення даної молекули на дві частини. В результаті гідролізу молекули призводить до значних змін архітектури даної молекули, в результаті якого

отримують інший потенціал взаємодії молекули з ферментами або іншими протеїнами. Як наслідок, гідролітичні процеси, як правило, мають значний вплив на біологічну активність речовини, включаючи її фунгіцидну активність, що зазвичай призводить до втрати біологічної та фунгіцидної активності, відповідно.

Хімічна стабільність щодо гідролізу амідинів, описаних в попередньому рівні техніки, є гарною, але покращена стабільність може бути перевагою під час процесів отримання та формулювання в великих масштабах.

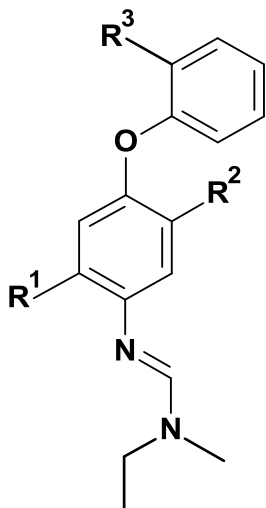
Відповідно, ще однією задачею представленого винаходу є забезпечити амідини, які мають покращену хімічну стабільність по відношенню до гідролізу.

Фотоліз, який також відомий як фоторозщеплення, фотодисоціація або фоторозкладання, представляє собою хімічний процес, при якому хімічна молекула розривається на менші одиниці за рахунок поглинання світла, тобто фотонів. В результаті, фотоліз молекули приводить до значних змін архітектури даної молекули, в результаті якого отримують відмінний потенціал взаємодії даної молекули з ферментами або іншими протеїнами. Як наслідок, фотолітичні процеси, як правило, мають значний вплив на біологічну активність речовини, включаючи її фунгіцидну активність, що зазвичай призводить до втрати біологічної та фунгіцидної активності, відповідно. Від Tsao та Eto відомим є те, що фоторозкладання є важливим абіотичним шляхом зникнення пестицидів, включаючи фунгіциди (дивіться Tsao and Eto, Agric. Biol. Chem., 55 (3), 763-768, 1991).

Стабільність по відношенню до фотолізу амідинів, описаних в попередньому рівні техніки, є гарною, але покращена стабільність може бути перевагою, оскільки це може забезпечити більш тривалу ефективність, коли їх застосовують до рослин за рахунок позакореневого внесення.

Відповідно, ще однією задачею представленого винаходу є забезпечити амідини, які мають покращену стабільність по відношенню до фотолізу.

Неочікувано, дані задачі були використані за допомогою галоген-заміщених феноксибензіламідинів формули (I)



(I)

в якій

R¹ вибирають з групи, яка складається з галогену та галогенметил;

R² являє собою метил;

R³ являє собою галоген.

Зазначені вище визначення радикалів можуть комбінуватися один з одним за бажанням.

Відповідно до типу замісників, визначених вище, сполуки формули (I) мають основні властивості та можуть утворювати солі, можливо також внутрішні солі або адукти, з неорганічними або органічними кислотами або з іонами металу. Сполуки формули (I) несуть амідинові групи, які індують основні властивості. Таким чином, дані сполуки можуть взаємодіяти з кислотами, даючи солі, або їх безпосередньо отримують як солі шляхом синтезу.

Солі, які можуть бути отримані таким чином, також мають фунгіцидні властивості.

Приклади неорганічних кислот включають галогеноводневі кислоти, такі як фтороводневу

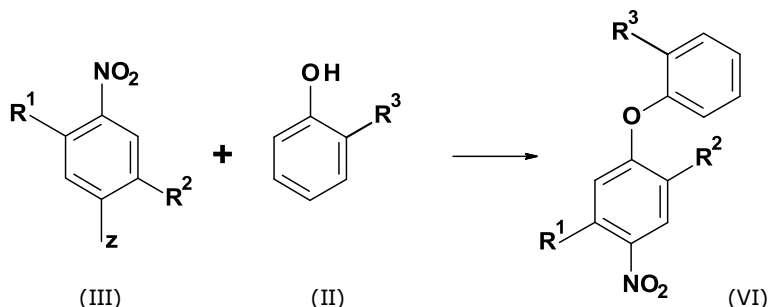
кислоту, хлороводневу кислоту, бромоводневу кислоту та йодоводневу кислоту, сірчану кислоту, фосфорну кислоту та азотну кислоту, та кислі солі, такі як NaHSO_4 та KHSO_4 . Як органічні кислоти підходять, наприклад, мурашина кислота, вугільна кислота та алканові кислоти, такі як оцтова кислота, трифтороцтова кислота, трихлороцтова кислота та пропіонова кислота, та також гліколева кислота, тіоціанова кислота, молочна кислота, бурштинова кислота, лимонна кислота, бензойна кислота, корична кислота, щавелева кислота, насичені або моно- або диненасичені $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ жирні кислоти, алкілсульфонові кислоти (сульфонові кислоти, які мають лінійний ланцюг або розгалужені алкільні радикали, які мають від 1 до 20 атомів вуглецю), арилсульфонові кислоти або арилдисульфонові кислоти (ароматичні радикали, такі як фенол та нафтил, які несуть одну або дві сульфонові кислотні групи), алкілфосфонові кислоти (фосфонові кислотами, які мають лінійний ланцюг або розгалужені алкільні радикали, які мають від 1 до 20 атомів вуглецю), арилфосфонові кислоти або арилдифосфонові кислоти (ароматичні радикали, такі як фенол та нафтил, які несуть один або два фосфонових кислотних радикали), де алкільні та арильні радикали можуть нести додаткові замісники, наприклад, п-толуолсульфорова кислота, саліцилова кислота, п-аміносаліцилова кислота, 2-феноксibenзойна кислота, 2-ацетоксибензойна кислота, тощо.

Використовувані іони металу представляють собою, зокрема, іони елементів другої головної групи, зокрема, кальцію та магнію, третьої та четвертої головної групи, зокрема, алюмінію та олова, та також з першої по восьму перехідні групи, зокрема, марганцю, заліза, кобальту, нікелю, міді, цинку та інших. Особлива перевага надається іонам металів елементів четвертого періоду. Метали можуть бути присутніми в різних валентностях, які вони можуть прийняти.

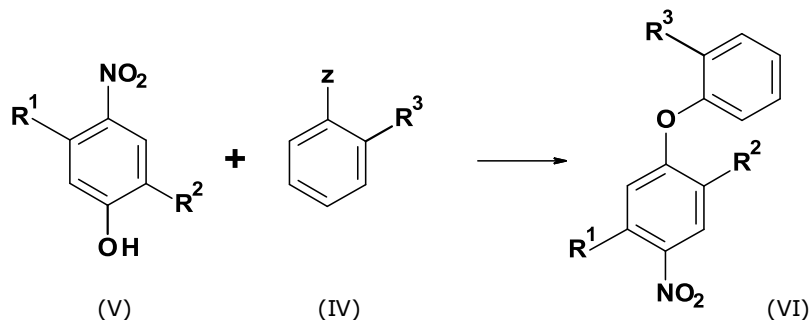
Необов'язково заміщені групи можуть бути моно- або полізаміщеними, де замісники, у випадку полізаміщення, можуть бути однаковими або різними.

Представлений винахід, крім того, передбачає спосіб отримання феноксифеніламінів, відповідно до винаходу, який включає, щонайменше, одну з наступних стадій від (а) до (j):

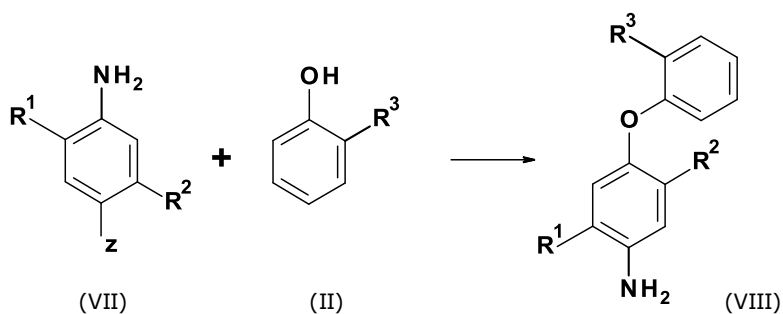
(а) взаємодію похідних нітробензолу формули (III) з похідними фенолу формули (II) відповідно до схеми реакції нижче:



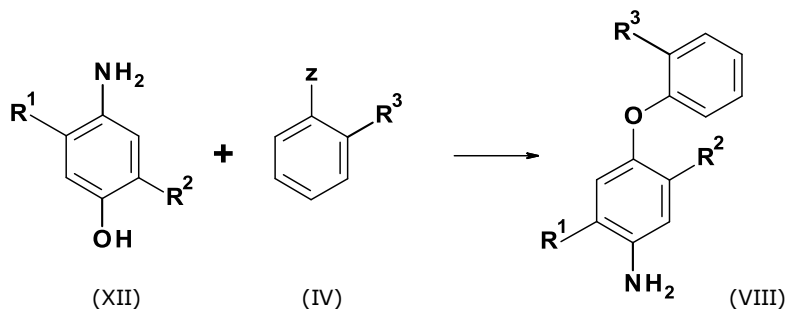
(b) взаємодію похідних нітрофенолу формули (V) з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:



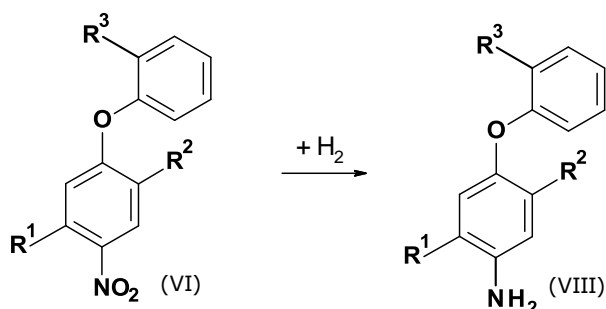
(c) взаємодію анілінів формули (VII) з фенолами (II) відповідно до схеми реакції нижче:



(d) взаємодію амінофенолів формули (XII) з похідними фенілу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:

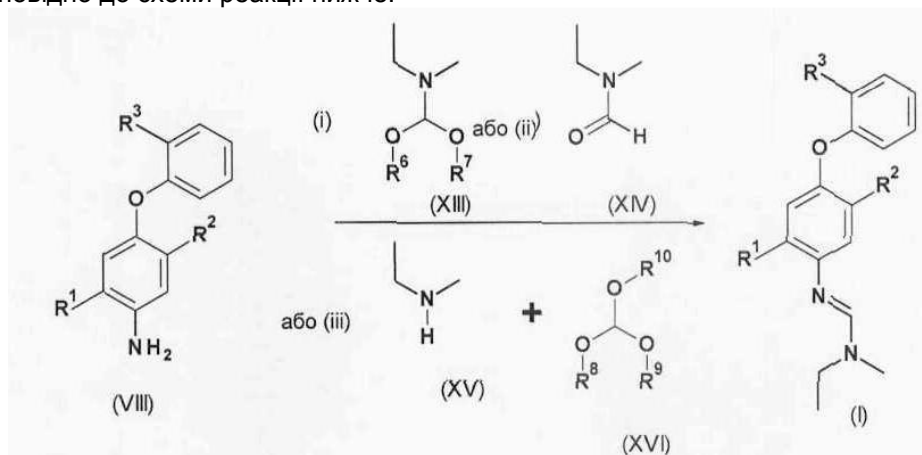


5 (e) взаємодію нітрофенілових простих ефірів формули (VI) з амінофеніловими простими ефірами формули (VIII) відповідно до схеми реакції нижче:



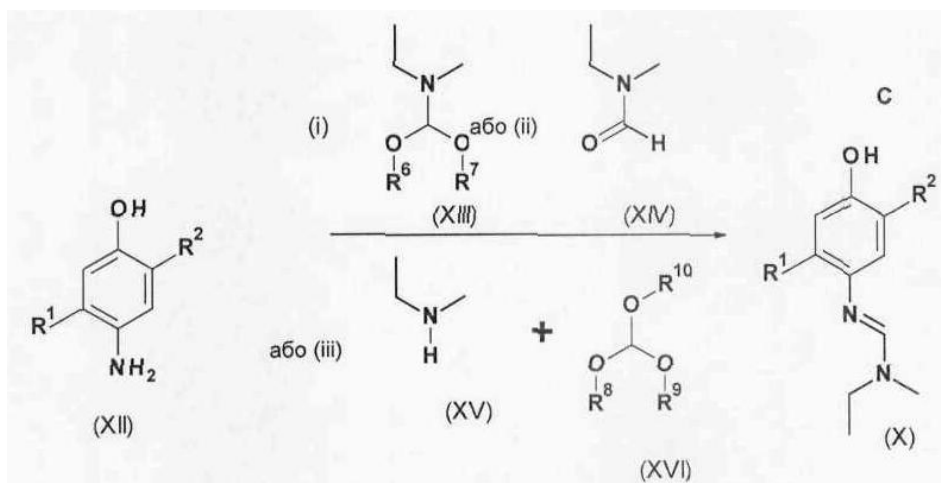
(f) взаємодію амінофенілових простих ефірів формули (VIII) з

- 10 (i) аміноацеталами формули (XIII) або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або
 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI)
 відповідно до схеми реакції нижче:

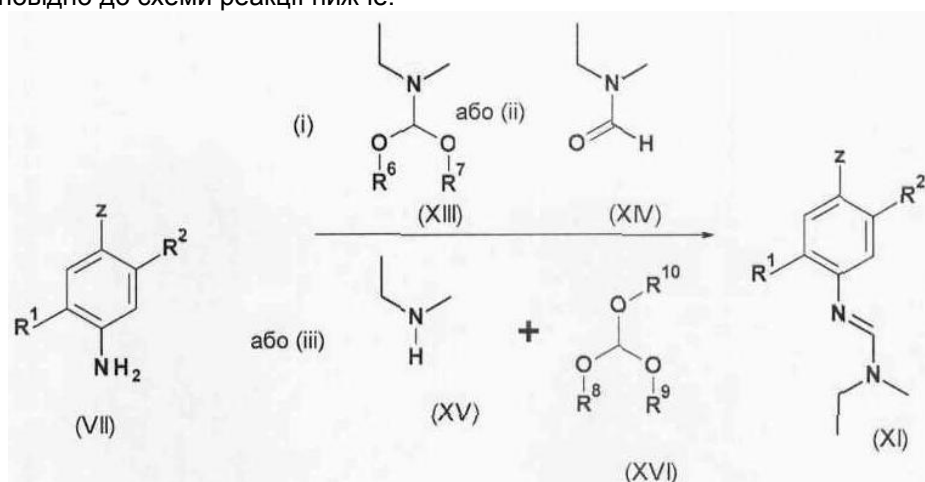


(g) взаємодію амінофенолів формули (XII) з

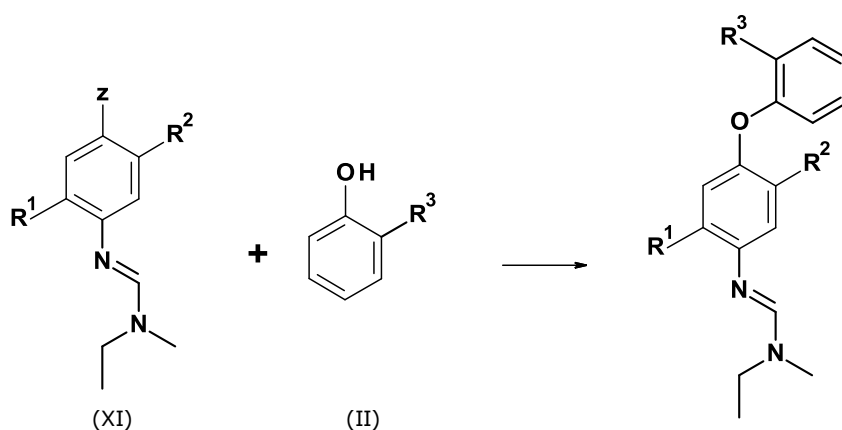
- 15 (i) аміноацеталами формули (XIII) або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або
 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI)
 відповідно до схеми реакції нижче:



- (h) взаємодію анілінів формули (VII) з
 (i) аміноацеталами формули (XIII) або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або
 5 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI)
 відповідно до схеми реакції нижче:

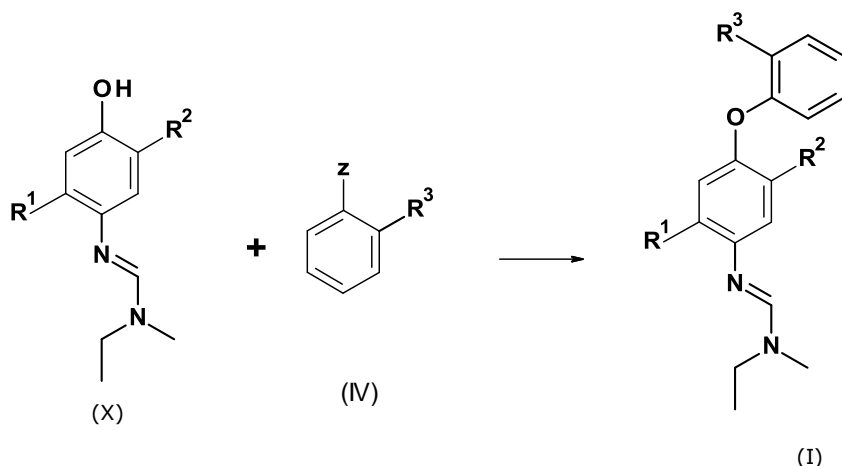


- (i) взаємодію амідинів формули (XI) з похідними фенолу формули (II) відповідно до схеми реакції нижче:



10

- (j) взаємодію амідинів формули (X) з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:



де в зазначених вище схемах

Z представляє собою групу, яка відщеплюється;

від R¹ до R³ мають значення, зазначені вище;

5 R⁶ та R⁷ незалежно один від одного вибирають з групи, яка складається з C₁₋₁₂-алкільної, C₂₋₁₂-алкенільної, C₂₋₁₂-алкінільної або C₅₋₁₈-арильної або C₇₋₁₉-арилалкільної груп та разом з атомами, до яких вони є приєднаними, можуть утворювати п'яти-, шести- або семи-членне кільце;

10 від R⁸ до R¹⁰ незалежно один від одного вибирають з групи, яка складається з C₁₋₁₂-алкільної, C₂₋₁₂-алкенільної, C₂₋₁₂-алкінільної або C₅₋₁₈-арильної, або C₇₋₁₉-арилалкільної, C₇₋₁₉-алкіларильної груп, та в кожному випадку R⁸ з R⁹, R⁹ з R¹⁰ або R⁸ з R¹⁰ разом з атомами, до яких вони є приєднаними, та, у випадку необхідності, разом з додатковим атомом вуглецю, азоту, кисню або сірки можуть утворювати п'яти-, шести- або семи-членне кільце.

15 Третій об'єкт винаходу представляє собою застосування галоген-заміщених феноксифеніламінінів відповідно до винаходу або агрохімічних композицій, які їх містять, для контролю за небажаними мікроорганізмами.

Четвертий об'єкт представленого винаходу представляє собою агрохімічну композицію для контролю за небажаними мікроорганізмами, яка містить щонайменше один з галоген-заміщених феноксифеніламінінів, відповідно до представленого винаходу.

20 Наступний об'єкт винаходу стосується способу контролю за небажаними мікроорганізмами, який характеризується тим, що галоген-заміщені феноксифеніламініни, відповідно до представленого винаходу, або агрохімічні композиції, які їх містять, застосовують до мікроорганізмів та/або їх середовища існування.

25 Більш того, винахід також стосується насіння, яке було оброблено, щонайменше, однією сполукою формули (I).

Винахід назавершення передбачає спосіб захисту насіння проти небажаних мікроорганізмів шляхом застосування насіння, обробленого, щонайменше, однією сполукою формули (I).

Загальні визначення

30 В зв'язку з представленим винаходом, термін галогени (X) включає, якщо не зазначено інше, ті елементи, які є вибраними з групи, яка складається з фтору, хлору, бром та йоду, де переважно використовуються фтор, хлор та бром, та особливо переважно використовуються фтор та хлор.

Необов'язково заміщені групи можуть бути моно- або полізаміщеними, де у випадку полізаміщення замісники можуть бути ідентичними або різними.

35 У визначенні символів, наведених в зазначених вище формулах, використовувались узагальнюючі терміни, які, як правило, є загальноприйнятими для наступних заміників:

Галоген: фтор, хлор, бром та йод, та переважно - фтор, хлор, бром, та більш переважно - фтор, хлор.

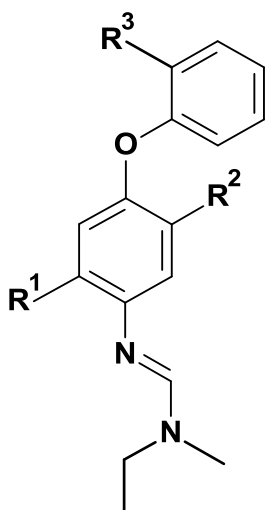
40 Галогенметил: метильна група, в якій деякі або всі атоми водню в даних групах, можуть бути заміщеними на атоми галогену, як зазначено вище, наприклад, (але не обмежується цим) хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил.

Не включеними є комбінації, які суперечать законам природи, та які кваліфікований фахівець в даній галузі, таким чином, вилучає з урахуванням своїх експертних знань.

45 В залежності від природи заміників, сполуки формули (I) можуть знаходитись в формі геометричних та/або оптично активних ізомерів або відповідних ізомерних сумішей в різних

композиціях. Дані стереоізомери представляють собою, наприклад, діастереомери, атропоізомери або геометричні ізомери. Відповідно, винахід охоплює як чисті стереоізомери, так і будь-яку суміш з даних ізомерів.

5 Галоген-заміщені феноксифеніламідини відповідно до винаходу представляють собою сполуки формули (I)



(I)

або їх солі, N-оксиди, комплекси металів та їх стереоізомери.

В формулі (I), групи мають значення, визначені нижче. Надані визначення також застосовують до всіх проміжних сполук:

10 R¹ вибирають з групи, яка складається з галогену та галогенметилу;

R² представляє собою метил;

R³ представляє собою галоген.

В формулі (I), групи мають переважні значення, визначені нижче. Визначення, надані як такі, які є переважними, аналогічним чином застосовують до всіх проміжних сполук:

15 R¹ переважно вибирають з групи, яка складається з фтору, хлору, бром, дихлорметилу, трихлорметилу, фторметилу, дифторметилу та трифторметилу;

R² переважно представляє собою метил;

R³ переважно вибирають з групи, яка складається з бром, хлору та фтору.

20 В формулі (I), радикали мають особливо переважні значення, визначені нижче. Визначення, надані як такі, які є особливо переважними, аналогічним чином застосовують до всіх проміжних сполук:

R¹ особливо переважно вибирають з групи, яка складається з хлору, бром, дифторметилу та трифторметилу;

R² особливо переважно представляє собою метил;

25 R³ особливо переважно представляє собою фтор та хлор.

Феноксифеніламідини переважно, в зв'язку з представленим винаходом, вибирають з групи, яка складається з:

(I-01)	N'-[2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-02)	N'-[2-(дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-03)	N'-[2-бром-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-04)	N'-[2-бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-05)	N'-[2-хлор-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-06)	N'-[2-хлор-4-(2-йодуфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду,	
(I-07)	N'-[2-бром-4-(2-бромфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-
метилімідоформаміду.	

35 Сполуки формули (I) несуть амідинові групи, які індукують основні властивості. Таким чином, дані сполуки можуть взаємодіяти з кислотами, даючи солі.

Приклади неорганічних кислот включають галогенводневі кислоти, такі як фтороводневу кислоту, хлороводневу кислоту, бромоводневу кислоту та йодоводневу кислоту, сірчану кислоту, фосфорну кислоту та азотну кислоту, та кислі солі, такі як NaHSO₄ та KHSO₄.

40 Прийнятні органічні кислоти представляють собою, наприклад, мурашину кислоту, вугільну кислоту та алканові кислоти, такі як оцтова кислота, трифтороцтова кислота, трихлороцтова кислота та пропіонова кислота, та також гліколева кислота, тіоціанова кислота, молочна кислота, бурштинова кислота, лимонна кислота, бензойна кислота, корична кислота, щавелева

кислота, алкілсульфонові кислоти (сульфонові кислоти, які мають лінійний ланцюг або розгалужені алкільні групи, які мають від 1 до 20 атомів вуглецю), арилсульфонові кислоти або –дисульфонові кислоти (ароматичні групи, такі як феніл та нафтил, які несуть одну або дві сульфонові кислотні групи), алкілфосфонові кислоти (фосфонові кислоти, які мають лінійний ланцюг або розгалужені алкільні групи, які мають від 1 до 20 атомів вуглецю), арилфосфонові кислоти або –дифосфонові кислоти (ароматичні радикали, такі як феніл та нафтил, які несуть одну або дві фосфонові кислотні групи), де алкільні та арильні групи можуть нести додаткові замісники, наприклад п-толуолсульфорова кислота, саліцилова кислота, п-аміносаліцилова кислота, 2-феноксипензойна кислота, 2-ацетоксипензойна кислота тощо.

Солі, які можуть бути отримані таким чином, також мають фунгіцидні властивості.

Отримання амідинів відповідно до винаходу

Амідини відповідно до винаходу можуть бути отримані за способом, показаним на схемі (I) нижче:

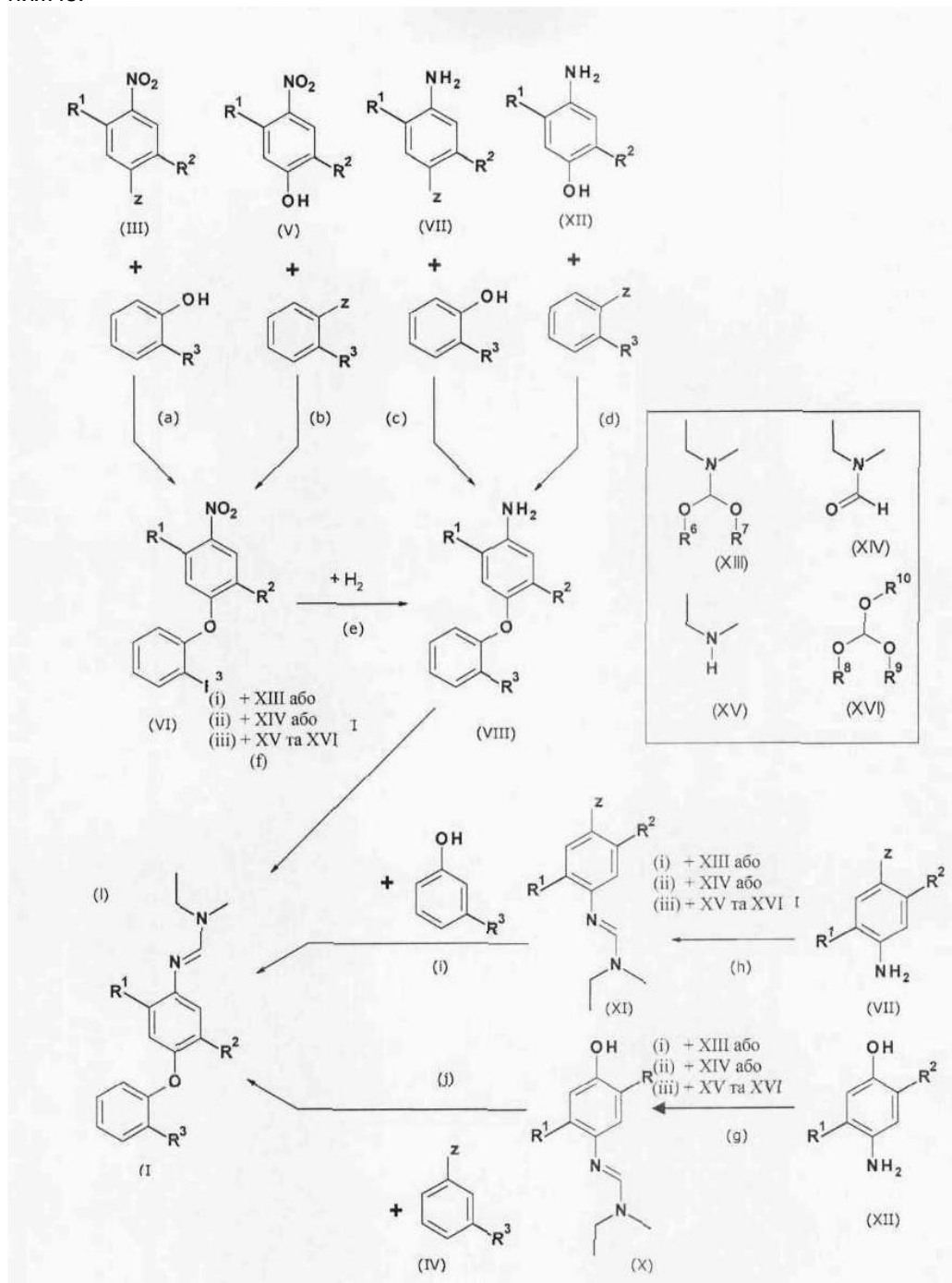
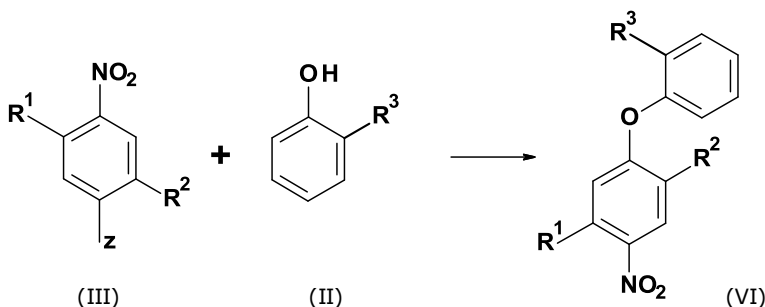


Схема (I)
Стадія (a)

В одному варіанті здійснення відповідно до винаходу, похідні нітробензолу формули (III) піддають взаємодії з похідними формули (II) або феноксидами, утвореними з них, відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи нітроароматичні сполуки формули (VI):



5 Прийнятні групи, які відщеплюються, (Z) представляють собою всі замісники, які мають достатню нуклеофобність в переважних реакційних умовах. Приклади прийнятних груп, які відщеплюються, які зазначаються, включають галогени, трифлат, мезилат, тозилат або SO₂Me.

10 Нові сполуки представляють собою ті, які мають формулу (VI), в якій символи R¹ та R² мають зазначені вище загальні, переважні, або особливо переважні визначення, та R³ вибирають з групи, яка складається з фтору та хлору.

Нові сполуки також представляють собою ті, які мають формулу (VI), в якій символи R² та R³ мають зазначені вище загальні, переважні, або особливо переважні визначення, та R¹ вибирають з групи, яка складається з фтору, бромю, йоду, та галогенметилу.

15 В контексті представленого винаходу, ті нітрофенілові прості ефіри формули (VI), які мають наступні комбінації з R¹, R² та R³, описані в таблиці I-a, є особливо переважними.

Таблиця I-a

№№	R ¹	R ²	R ³
(VI-01)	Cl	Me	F
(VI-02)	CHF ₂	Me	F
(VI-03)	Br	Me	F
(VI-04)	Br	Me	Cl
(VI-05)	Cl	Me	Cl
(VI-06)	Cl	Me	I
(VI-07)	Br	Me	Br

В контексті представленого винаходу, ті нітрофенілові прості ефіри формули (VI), які мають наступні комбінації з R¹, R² та R³, описані в таблиці I-b, є особливо переважними.

Таблиця I-b

№№	R ¹	R ²	R ³
(VI-08)	Cl	Me	Br
(VI-09)	CHF ₂	Me	I

Реакцію переважно здійснюють в присутності основи.

25 Прийнятні основи представляють собою органічні та неорганічні основи, які, як правило, використовують в таких реакціях. Перевага надається застосуванню основ, які, наприклад, вибирають з групи, яка складається з гідридів, гідроксидів, амідів, алкоксидів, ацетатів, фторидів, фосфатів, карбонатів та бікарбонатів лужних металів або лужноземельних металів. Особлива перевага надається в даному документі натрію амиду, натрію гідриду, літію діізопропіламиду, натрію метоксиду, калію трет-бутоксиду, натрію гідроксиду, калію гідроксиду, натрію ацетату, натрію фосфату, калію фосфату, калію фториду, цезію фториду, натрію карбонату, калію карбонату, калію бікарбонату, натрію бікарбонату та цезію карбонату. Крім того, третинні аміни, такі як, наприклад, триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N, N-диметиланілін, N, N-диметилбензиламін, піридин, N-метилпіридин, N-метилпіролідон, N, N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) та діазабіциклоундецен (DBU).

35 У випадку необхідності, використовуваним може бути каталізатор, вибраний з групи, яка

складається з паладію, міді та їх солей або комплексів.

Взаємодію похідної нітробензолу з похідною фенолу можуть здійснювати в чистому вигляді або в розчиннику; переважно, взаємодію здійснюють в розчиннику, вибраному зі стандартних розчинників, які є інертними в переважних реакційних умовах.

5 Перевага надається аліфатичним, аліциклічним або ароматичним вуглеводням, таким як, наприклад, петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогенованим вуглеводням, таким як, наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, дихлоретан або трихлоретан; простим ефірам, таким як, наприклад, діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, метил-трет-бутиловий ефір (МТБЕ), метил-трет-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан, 1,2-діетоксіетан або анізол; нітрилам, таким як, наприклад, ацетонітрил, пропіонітрил, n- або ізобутиронітрил або бензонітрил; амідам, таким як, наприклад, N, N-диметилформамід (ДМФ), N, N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон (NMP) або гексаметиленфосфорний триамід; або їх суміші з водою, та також чиста вода.

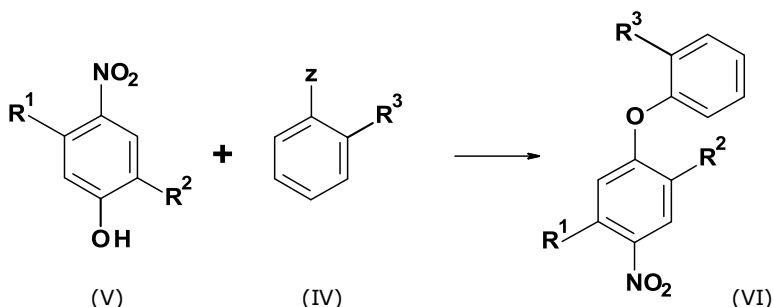
15 Взаємодію можуть здійснювати при зниженому тиску, при атмосферному тиску або при тиску вищому за атмосферний та при температурах від - 20 до 200 °С; переважно, реакцію здійснюють при атмосферному тиску та температурах від 50 до 150 °С.

20 Похідні нітробензолу формули (III) є комерційно доступними або можуть бути отримані з комерційно доступних попередників за або аналогічними способами, до тих які описані в літературі (наприклад WO 2008/110314).

Похідні фенолу формули (II) є комерційно доступними.

Стадія (b)

25 В альтернативному варіанті здійснення відповідно до винаходу, похідні нітрофенолу формули (V) або феноксида, утворені з них, піддають взаємодії з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи нітрофенілові прості ефіри формули (VI):



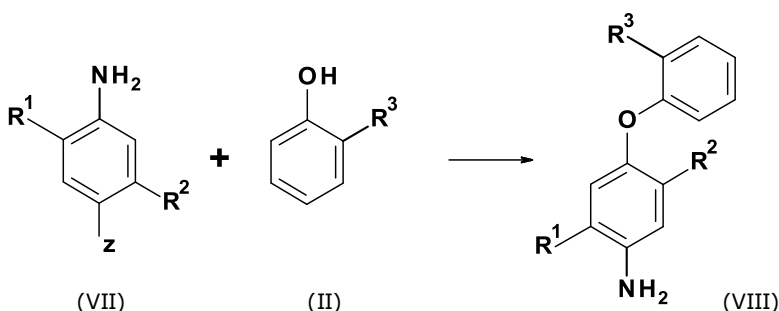
Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів, характеру замісників нітрофенілового простого ефіру (VI) та прийнятних груп, які відщеплюються, посилання може бути зроблене на стадію (a).

30 Похідні нітрофенолу формули (V) є комерційно доступними або можуть бути отримані з комерційно доступних попередників за способами, описаними в літературі (наприклад, з відповідних похідних нітрофенолу за реакцією галогенування: WO 2009/140624).

Фенільні похідні формули (IV) є комерційно доступними.

Стадія (c)

35 В наступному альтернативному варіанті здійснення відповідно до винаходу, анілінові похідні формули (VII) піддають взаємодії з похідними фенолу формули (II) або феноксидами, утвореними з них, відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи амінофенілові прості ефіри формули (VIII):



40 Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів та прийнятних груп, які відщеплюються, посилання може бути зроблене на стадію (a).

Нові сполуки представляють собою сполуки формули (VIII), в яких символи R^1 та R^3 мають зазначені вище загальні, переважні, або особливо переважні визначення та R^2 вибирають з групи, яка складається з фтору, бром, йоду, та галогенметилу.

В контексті представленого винаходу дані амінофенілові прості ефіри формули (VIII), які мають наступні комбінації з R^1 , R^2 та R^3 , описані в таблиці II-a, є особливо переважними.

Таблиця II-a

№№	R^1	R^2	R^3
(VIII-01)	Cl	Me	F
(VIII-02)	CHF ₂	Me	F
(VIII-03)	Br	Me	F
(VIII-04)	Br	Me	Cl
(VIII-05)	Cl	Me	Cl
(VIII-06)	Cl	Me	I
(VIII-07)	Br	Me	Br

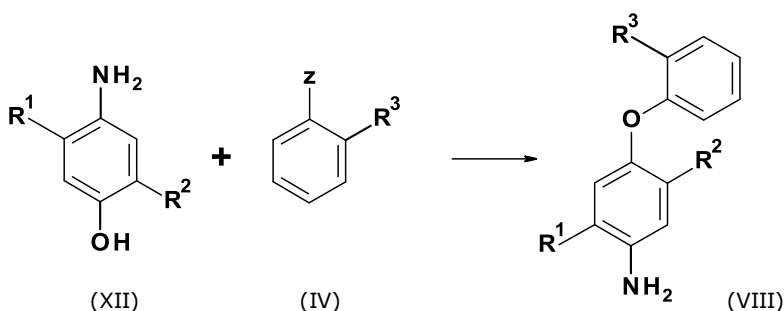
В контексті представленого винаходу ті нітрофенілові прості ефіри формули (VIII), які мають наступні комбінації з R^1 , R^2 та R^3 , описані в таблиці II-b, є особливо переважними.

Таблиця II-b

No.	R^1	R^2	R^3
(VIII-08)	Cl	Me	Br

Стадія (d)

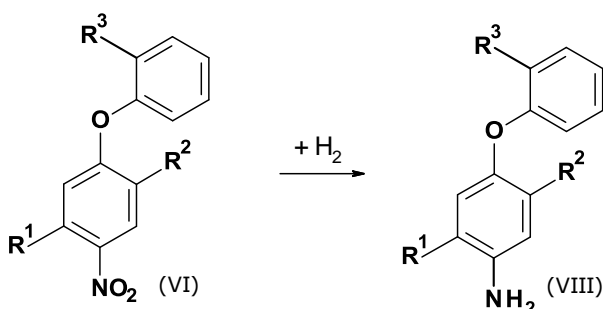
В наступному альтернативному варіанті здійснення відповідно до винаходу, амінофеноли формули (XII) піддають взаємодії з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи амінофенілові прості ефіри формули (VIII):



Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів, характеру замісників амінофенілового простого ефіру (VIII) та прийнятних груп, які відщеплюються, посилання може бути зроблене на стадії (a) та (c).

Стадія (e)

Нітрофенілові прості ефіри формули (VI), отримані на стадіях (a) та (b), можуть бути відновленими відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи амінофенілові прості ефіри формули (VIII):



Відновлення відповідно до стадії (e) може бути здійснено за будь-яким зі способів відновлення нітро групи, описаних в попередньому рівні техніки.

Переважно, відновлення здійснюють, застосовуючи хлорид олова в концентрований

хлороводневій кислоті, як описано в WO 2000/46184. Однак, альтернативно, відновлення також може бути здійснено шляхом застосування заліза в присутності хлороводневої кислоти або газоподібного водню, у випадку необхідності в присутності прийнятних каталізаторів гідрогенезування, таких як, наприклад, нікель Ренея або Pd/C. Умови реакції вже були описані в попередньому рівні техніки та є знайомими для кваліфікованого фахівця в даній галузі з рівня техніки.

Якщо відновлення здійснюють в рідкій фазі, реакція повинна проводитись в розчиннику, інертному в переважних реакційних умовах. Одним з таких розчинників є, наприклад, толуол, метанол, або етанол.

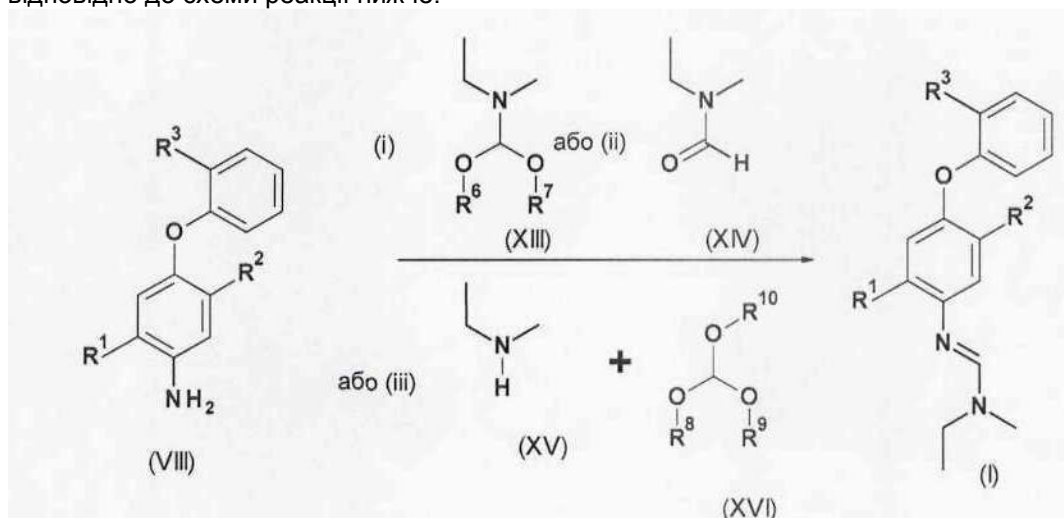
Стадія (f)

Перетворення анілінів формули (VIII) в амідини формули (I) відповідно до винаходу відповідно до стадії (f) можуть здійснювати, як показано вище на схемі (I), застосовуючі різні альтернативні способи реалізації з:

(i) аміноацеталіями формули (XIII) або

(ii) N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або

(iii) N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI) відповідно до схеми реакції нижче:



Конкретні альтернативні варіанти здійснення з (i) по (iii) способу відповідно до винаходу є коротко проілюстрованими нижче:

(i) Відповідно до одного варіанта здійснення відповідно до винаходу, показаного на схемі (I) як стадія (i), амінофенілові прості ефіри формули (VIII) піддають взаємодії з аміноацеталіями формули (XIII), при цьому R⁶ та R⁷ вибирають з групи, яка складається з C₁₋₈-алкільної групи, переважно з C₁₋₆-алкільної групи, особливо переважно з C₁₋₄-алкільної групи та разом з атомами кисню, до яких вони є приєднаними, можуть утворювати п'яти- або шести-членне кільце, отримуючи галоген-заміщені феноксифеніламідини формули (I) відповідно до винаходу.

Аміноацеталі формули (XIII) можуть бути отримані з N-етил-N-метилформаміду, описаного в JACS, 65, 1566 (1943), за реакцією з алкілюючими агентами, такими як, наприклад, диметилсульфат.

Реакцію відповідно до стадії (i) переважно здійснюють за відсутності основи або кислоти.

(ii) В альтернативному варіанті здійснення відповідно до винаходу, показаного на схемі (I) як стадія (ii), амінофенілові прості ефіри формули (VIII) піддають взаємодії з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV), отримуючи галоген-заміщені феноксифеніламідини відповідно до винаходу.

Реакцію відповідно до стадії (ii), у випадку необхідності, здійснюють в присутності галогенуючого агента. Прийнятні галогенуючі агенти, наприклад, вибирають з групи, яка складається з PCl₅, PCl₃, POCl₃ або SOCl₂.

Більш того, реакція альтернативно може бути здійснена в присутності конденсуючого агента.

Прийнятні конденсуючі агенти, як правило, представляють собою ті, які застосовують для утворення амідних зв'язків; як приклади зазначеними можуть бути утворювачі галогенангідридів, такі як, наприклад, фосген, фосфору трибромід, фосфору трихлорид, фосфору пентахлорид, фосфору окситрихлорид або тіонілхлорид; утворювачі ангідридів, такі як, наприклад, хлорформіат, метилхлорформіат, ізопропілхлорформіат, ізобутилхлорформіат або метансульфонілхлорид; карбодііміни, такі як, наприклад, N, N'-дициклогексилкарбодіімін (DCC)

або інші загальноприйняті конденсуючі агенти, такі як, наприклад, фосфору пентоксид, поліфосфорна кислота, N, N'-карбодімідазол, 2-етоксі-N-етоксикарбоніл-1,2-дигідрохінолін (EEDQ), трифенілфосфін/тетрахлорид вуглецю або бромтрипіролідинофосфонію гексафторфосфат.

5 Реакцію відповідно до стадія (ii) переважно здійснюють в розчиннику, який вибирають зі стандартних розчинників, які є інертними в переважних реакційних умовах. Перевага надається аліфатичним, аліциклічним або ароматичним вуглеводням, таким як, наприклад, петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогенованим вуглеводням, таким як, наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, 10 хлороформ, тетрахлорид вуглецю, дихлоретан або трихлоретан; простим ефірам, таким як, наприклад, діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, метил-трет-бутиловий ефір (МТБЕ), метил-трет-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан, 1,2-діетоксіетан або анізол; нітрилам, таким як, наприклад, ацетонітрил, пропіонітрил, n- або ізобутиронітрил або бензонітрил; амідам, таким як, наприклад, N, N-диметилформамід (ДМФ), N, N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон (NMP) або гексаметиленфосфорний 15 триамід; складним ефірам, таким як, наприклад, метилацетат або етилацетат; сульфоксидам, таким як, наприклад, диметилсульфоксид (ДМСО); сульфонам, таким як, наприклад, сульфолан; спиртам, таким як, наприклад, метанол, етанол, n- або ізопропанол, n-, ізо-, втор- або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксіетанол, метоксіетанол, діетиленгліколь-монометиловий простий ефір, діетиленгліколь-моноетиловий простий ефір або їх суміші. 20

(iii) Відповідно до наступного альтернативного варіанта здійснення відповідно до винаходу, показаного на схемі (I) як стадія (iii), амінофенілові прості ефіри формули (VIII) піддають взаємодії з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI), в яких R⁸-R¹⁰ незалежно один від одного вибирають з групи, яка складається з C₁₋₈-алкільної групи, переважно з C₂₋₆-алкільної групи, особливо переважно з C₃₋₅-алкільної групи та разом з атомами кисню, до яких вони є приєднаними, можуть утворювати п'яти- або шести- 25 членне кільце, отримуючи галоген-заміщені феноксифеніламідини відповідно до винаходу.

Реакцію відповідно до стадія (iii) переважно здійснюють в розчиннику, який вибирають зі стандартних розчинників, які є інертними в переважних реакційних умовах. Перевага надається аліфатичним, аліциклічним або ароматичним вуглеводням, таким як, наприклад, петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогенованим вуглеводням, таким як, наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, дихлоретан або трихлоретан; простим ефірам, таким як, наприклад, діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, метил-трет-бутиловий ефір (МТБЕ), метил-трет-аміловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан, 1,2-діетоксіетан або анізол; нітрилам, таким як, наприклад, ацетонітрил, пропіонітрил, n- або ізобутиронітрил або бензонітрил; амідам, таким як, наприклад, N, N-диметилформамід (ДМФ), N, N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон (NMP) або гексаметиленфосфорний 35 триамід; складним ефірам, таким як, наприклад, метилацетат або етилацетат; сульфоксидам, таким як, наприклад, диметилсульфоксид (ДМСО); сульфонам, таким як, наприклад, сульфолан; спиртам, таким як, наприклад, метанол, етанол, n- або ізопропанол, n-, ізо-, втор- або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксіетанол, метоксіетанол, діетиленгліколь-монометиловий простий ефір, діетиленгліколь-моноетиловий простий ефір; або їх суміші з водою та також чистій воді. 40

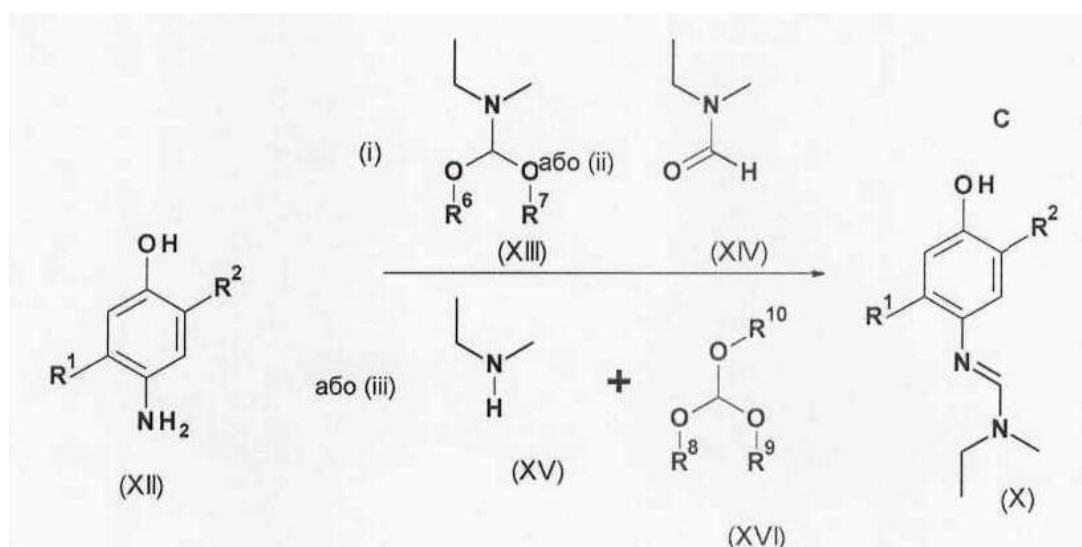
45 Стадія (g)

В альтернативному варіанті здійснення, відповідно до винаходу, можливою вже є взаємодія амінофенолів формули (XII)

(i) з аміноацеталями формули (XIII) або

(ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або

50 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI) відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи амідини формули (X):



Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів та характерів заміщення амідинів (X), посилання може бути зроблене на стадію (f) та на таблиці I та II.

Наступне перетворення амідинів формули (X) в цільові молекули формули (I), відповідно до винаходу, можуть здійснювати, наприклад, як описано на стадії (j).

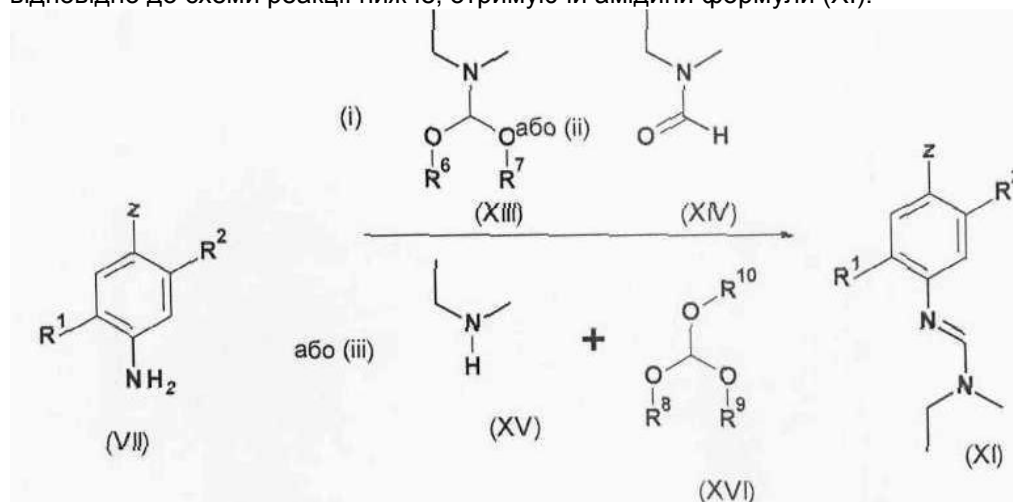
Стадія (h)

В альтернативному варіанті здійснення відповідно до винаходу, можливою є взаємодія анілінових похідних формули (VII)

(i) з аміноацеталами формули (XIII) або

(ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або

(iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI) відповідно до схеми реакції нижче, отримуючи амідини формули (XI):

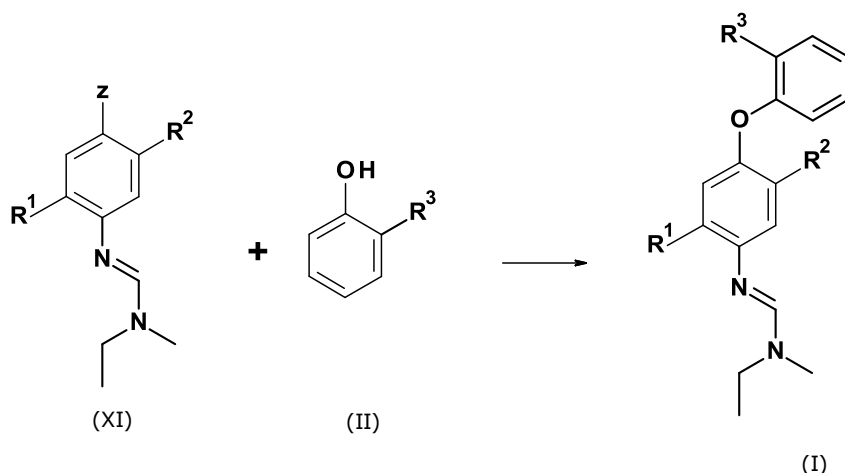


Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів та характерів заміщення амідинів (XI), посилання може бути зроблене на стадію (f) та на таблиці I та II.

Наступне перетворення амідинів формули (XI) в цільові молекули формули (I) відповідно до винаходу можуть здійснювати, наприклад, як описано на стадії (i).

Стадія (i)

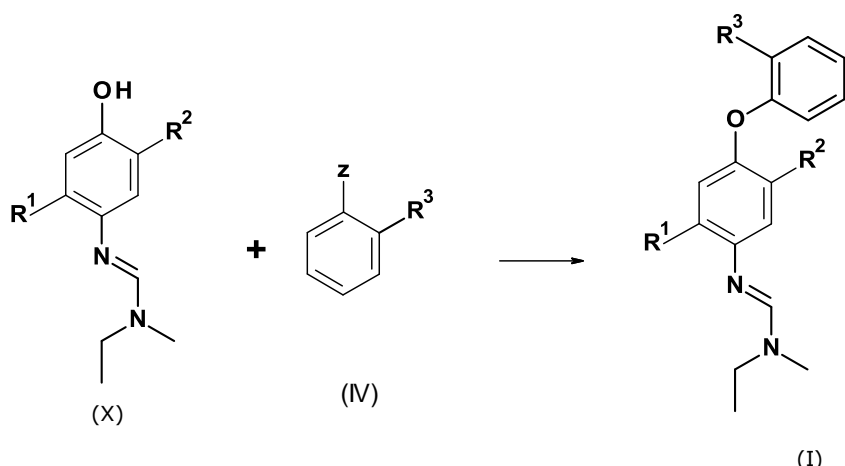
Відповідно до наступного варіанта здійснення, відповідно до винаходу, амідини формули (XI), які можуть бути отримані зі стадії (h), можуть взаємодіяти з похідними фенолу формули (II) або феноксидами, утвореними з них, отримуючи цільові молекули формули (I), відповідно до винаходу, відповідно до схеми реакції нижче:



Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів, характеристик заміщення амідинів (I), посилання може бути зроблене на стадії (a) та (c) та на таблиці I та II.

Стадія (j)

- 5 Відповідно до наступного варіанта здійснення відповідно до винаходу, амідини формули (X), які можуть бути отримані зі стадії (g), можуть взаємодіяти з похідними фенолу формули (IV), отримуючи цільові молекули формули (I), відповідно до винаходу, відповідно до схеми реакції нижче:



- 10 Стосовно умов реакції, розчинників, каталізаторів та характеристик заміщення амідинів (I), посилання може бути зроблене на стадії (a) та (c) та на таблиці I та II.

Стосовно способів отримання амідинів формули (I), відповідно до винаходу, наступні комбінації стадій реакції слід розглядати як переважні: стадії (a), (e) та (f); стадії (b), (e) та (f); стадії (c) та (f); стадії (d) та (f); стадії (h) та (i) та/або стадії (g) та (j).

- 15 Отримання галоген-заміщених феноксибеніламідинів, відповідно до винаходу, у випадку необхідності, здійснюють без проміжного виділення проміжних сполук.

Кінцеву очистку галоген-заміщених феноксибеніламідинів, у випадку необхідності, можуть здійснювати застосовуючи загальноприйняті способи очистки. Переважно, очистку здійснюють шляхом кристалізації.

- 20 Контроль за небажаними мікроорганізмами

Сполуки формули (I) мають потенційну мікробіцидну активність та можуть використовуватись для контролю за небажаними мікроорганізмами, такими як гриби та бактерії, для захисту сільськогосподарських культур, для захисту матеріалів в медичних та в немедичних застосуваннях.

- 25 Захист рослин

Сполуки формули (I) мають дуже гарні фунгіцидні властивості та можуть використовуватись для захисту сільськогосподарських культур, наприклад, для контролю за Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes та Deuteromycetes.

- 30 Бактерициди можуть використовуватись для захисту сільськогосподарських культур, наприклад, для контролю за Pseudomonadaceae, Xanthomonas, Rhizobiaceae,

Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae та Streptomycetaceae.

Сполуки формули (I) можуть використовуватись для лікувального або захисного контролю за фітопатогенними грибами. Винахід, таким чином, також стосується лікувальних та захисних способів контролю за фітопатогенними грибами шляхом застосування активних інгредієнтів або композицій за винаходом, які застосовують до насіння, рослини або частин рослини, плоду або ґрунту, в якому рослини ростуть.

Зазначення може бути зроблене, з використанням необмежуваних прикладів, деяких патогенів грибкових та бактеріальних захворювань, які підпадають під загальні терміни, перераховані вище:

10 захворювання, викликані порошкоподібними патогенами несправжньої борошністої роси, наприклад, видом *Blumeria*, наприклад, *Blumeria graminis*; видом *Podosphaera*, наприклад, *Podosphaera leucotricha*; видом *Sphaerotheca*, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*; видом *Uncinula*, наприклад, *Uncinula necator*;

15 захворювання, викликані патогенами захворювання іржі, наприклад, видом *Gymnosporangium*, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*; видом *Hemileia*, наприклад, *Hemileia vastatrix*; видом *Phakopsora*, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomia*; видом *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* або *Puccinia striiformis*; видом *Uromyces*, наприклад, *Uromyces appendiculatus*;

20 захворювання, викликані патогенами, вибраними з групи ооміцетів, наприклад, виду *Albugo*, наприклад, *Albugo candida*; виду *Bremia*, наприклад, *Bremia lactucae*; виду *Peronospora*, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*; виду *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora infestans*; виду *Plasmopara*, наприклад, *Plasmopara viticola*; виду *Pseudoperonospora*, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*; виду *Pythium*, наприклад, *Pythium ultimum*;

25 захворювання п'ятнистості листя огірків та захворювання зів'ялості листя, викликані, наприклад, видом *Alternaria*, наприклад, *Alternaria solani*; видом *Cercospora*, наприклад, *Cercospora beticola*; видом *Cladosporium*, наприклад, *Cladosporium cucumerinum*; видом *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (конідіальна форма: *Drechslera*, синонім: *Helminthosporium*) або *Cochliobolus miyabeanus*; видом *Colletotrichum*, наприклад, *Colletotrichum lindemuthianum*; видом *Cycloconium*, наприклад, *Cycloconium oleaginum*; видом *Diaporthe*, наприклад, *Diaporthe citri*; видом *Elsinoe*, наприклад, *Elsinoe fawcettii*; видом *Gloeosporium*, наприклад, *Gloeosporium laeticolor*; видом *Glomerella*, наприклад, *Glomerella cingulata*; видом *Guignardia*, наприклад, *Guignardia bidwelli*; видом *Leptosphaeria*, наприклад, *Leptosphaeria maculans*; видом *Magnaporthe*, наприклад, *Magnaporthe grisea*; видом *Microdochium*, наприклад, *Microdochium nivale*; видом *Mycosphaerella*, наприклад, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* або *Mycosphaerella fijiensis*; видом *Phaeosphaeria*, наприклад, *Phaeosphaeria nodorum*; видом *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora teres* або *Pyrenophora tritici repentis*; видом *Ramularia*, наприклад, *Ramularia collo-cygni* або *Ramularia areola*; видом *Rhynchosporium*, наприклад, *Rhynchosporium secalis*; видом *Septoria*, наприклад, *Septoria apii* або *Septoria lycopersici*; видом *Stagonospora*, наприклад, *Stagonospora nodorum*; видом *Typhula*, наприклад, *Typhula incarnata*; видом *Venturia*, наприклад, *Venturia inaequalis*;

40 захворювання кореня та стебла, викликані, наприклад, видом *Corticium*, наприклад, *Corticium graminearum*; видом *Fusarium*, наприклад, *Fusarium oxysporum*; видом *Gaeumannomyces*, наприклад, *Gaeumannomyces graminis*; видом *Plasmodiophora*, наприклад, *Plasmodiophora brassicae*; видом *Rhizoctonia*, наприклад, *Rhizoctonia solani*; видом *Sarocladium*, наприклад, *Sarocladium oryzae*; видом *Sclerotium*, наприклад, *Sclerotium oryzae*; видом *Tapesia*, наприклад, *Tapesia acuformis*; видом *Thielaviopsis*, наприклад, *Thielaviopsis basicola*;

45 захворювання колоска та волоті (включаючи кукурудзяні качани), викликані, наприклад, видом *Alternaria*, наприклад, *Alternaria* spp.; видом *Aspergillus*, наприклад, *Aspergillus flavus*; видом *Cladosporium*, наприклад, *Cladosporium cladosporioides*; видом *Claviceps*, наприклад, *Claviceps purpurea*; видом *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*; видом *Gibberella*, наприклад, *Gibberella zeae*; видом *Monographella*, наприклад, *Monographella nivalis*; видом *Stagonospora*, наприклад, *Stagonospora nodorum*;

50 захворювання, викликані головневими грибами, наприклад, видом *Sphacelotheca*, наприклад, *Sphacelotheca reiliana*; видом *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries* або *Tilletia controversa*; видом *Urocystis*, наприклад, *Urocystis occulta*; видом *Ustilago*, наприклад, *Ustilago nuda*;

55 викликані фруктовою гниллю, наприклад, видом *Aspergillus*, наприклад, *Aspergillus flavus*; видом *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*; видом *Penicillium*, наприклад, *Penicillium expansum* або *Penicillium purpurogenum*; видом *Rhizopus*, наприклад, *Rhizopus stolonifer*; видом *Sclerotinia*, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*; видом *Verticillium*, наприклад, *Verticillium albo-atrum*;

захворювання гниллю та зів'ялістю, які передаються через насіння та ґрунт, та також захворювання розсади, викликані, наприклад, видом *Alternaria*, наприклад, *Alternaria brassicicola*; видом *Aphanomyces*, наприклад, *Aphanomyces euteiches*; видом *Ascochyta*, наприклад, *Ascochyta lentis*; видом *Aspergillus*, наприклад, *Aspergillus flavus*; видом Cladosporium, наприклад, *Cladosporium herbarum*; видом *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (конідіальна форма: *Drechslera*, *Bipolaris* синонім: *Helminthosporium*); видом *Colletotrichum*, наприклад, *Colletotrichum coccodes*; видом *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*; видом *Gibberella*, наприклад, *Gibberella zeae*; видом *Macrophomina*, наприклад, *Macrophomina phaseolina*; видом *Microdochium*, наприклад, *Microdochium nivale*; видом Monographella, наприклад, *Monographella nivalis*; видом *Penicillium*, наприклад, *Penicillium expansum*; видом *Phoma*, наприклад, *Phoma lingam*; видом *Phomopsis*, наприклад, *Phomopsis sojae*; видом *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora cactorum*; видом *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora graminea*; видом *Pyricularia*, наприклад, *Pyricularia oryzae*; видом *Pythium*, наприклад, *Pythium ultimum*; видом *Rhizoctonia*, наприклад, *Rhizoctonia solani*; видом *Rhizopus*, наприклад, *Rhizopus oryzae*; видом *Sclerotium*, наприклад, *Sclerotium rolfsii*; видом *Septoria*, наприклад, *Septoria nodorum*; видом *Typhula*, наприклад, *Typhula incarnata*; видом *Verticillium*, наприклад, *Verticillium dahliae*;

злаякісні новоутворення, гали та відьмині мітли, викликані, наприклад, видом *Nectria*, наприклад, *Nectria galligena*;

захворювання зів'ялості, викликані, наприклад, видом *Monilinia*, наприклад, *Monilinia laxa*; деформації листя, квітів та плодів, викликані, наприклад, видом *Exobasidium*, наприклад, *Exobasidium vexans*; видом *Taphrina*, наприклад, *Taphrina deformans*;

дегенеративні захворювання у деревних рослин, викликані, наприклад, видом *Esca*, наприклад, *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* або *Fomitiporia mediterranea*; видом *Ganoderma*, наприклад, *Ganoderma boninense*;

захворювання квітів та насіння, викликані, наприклад, видом *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*;

захворювання бульб рослин, викликані, наприклад, видом *Rhizoctonia*, наприклад, *Rhizoctonia solani*; видом *Helminthosporium*, наприклад, *Helminthosporium solani*;

захворювання, викликані бактеріальними патогенними, наприклад, видом *Xanthomonas*, наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видом *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видом *Erwinia*, наприклад, *Erwinia amylovora*.

Перевага надається контролю за наступними захворюваннями соєвих бобів:

Грибкові захворювання на листя, стеблах, стручках та насінні, викликані, наприклад, плямистістю листя *Alternaria* (*Alternaria* spec. *atrans tenuissima*), *Anthraco*se (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), коричневою плямистістю (*Septoria glycines*), церкоспорною плямистістю листя та фітофторозом (*Cercospora kikuchii*), фітофторозом листя *choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), плямистістю листя *dactuliophora* (*Dactuliophora glycines*), пухнастою несправжньою борошністою росю (*Peronospora manshurica*), фітофторозом *drechslera* (*Drechslera glycini*), кільцевою плямистістю листя (*Cercospora sojae*), плямистістю листя *leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), філостиктозною плямистістю листя (*Phyllosticta sojaecola*), фітофторозом стручка та стебла (*Phomopsis sojae*), порошкоподібною несправжньою борошністою росю (*Microsphaera diffusa*), піренокаетовою плямистістю листя (*Pyrenochaeta glycines*), ризоктоніозом повітря, листя, та павутинним фітофторозом (*Rhizoctonia solani*), іржею (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*), лишайником (*Sphaceloma glycines*), плямистістю листя через стемфіліоз (*Stemphylium botryosum*), мішенеподібною плямистістю (*Corynespora cassicola*).

Грибкові захворювання на коріннях та стебловій основі, обумовлені, наприклад, чорною кореневою гниллю (*Calonectria crotalariae*), вугільною гниллю (*Macrophomina phaseolina*), фузаріозною гниллю або зів'янням, кореневою гниллю, та стручковою та вузловою гниллю (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), кореневою гниллю *mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*), *neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfesta*), зів'янням, гниллю, руйнуванням стручка та стебла (*Diaporthe phaseolorum*), некрозом стебла (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фітофторозною гниллю (*Phytophthora megasperma*), коричневою гниллю стебла (*Phialophora gregata*), питіозною гниллю (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), коріневою гниллю різокотонії, руйнуванням стебла, та випріванням (*Rhizoctonia solani*), руйнуванням стебла пріллю (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероціальною південною гниллю (*Sclerotinia rolfsii*), кореневою гниллю тілевіопсиса (*Thielaviopsis basicola*).

Переважно, наступним захворюванням сої є можливим протидіяти:

грибковим захворюванням на листя, стеблах, стручках та насінні, які викликані, наприклад, плямистістю листя *Alternaria* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), *Anthraco* (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*), коричневою плямистістю (*Septoria glycines*), церкоспорною плямистістю листя та фітофторозом (*Cercospora kikuchii*), фітофторозом листя *choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), плямистістю листя *dactuliophora* (*Dactuliophora glycines*), пухнастою несправжньою борошнистою россою (*Peronospora manshurica*), фітофторозом *drechslera* (*Drechslera glycini*), кільцевою плямистістю листя (*Cercospora sojae*), плямистістю листя *leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), філостиктозною плямистістю листя (*Phyllosticta sojaecola*), фітофторозом стручка та стебла (*Phomopsis sojae*), порошкоподібною несправжньою борошнистою россою (*Microsphaera diffusa*), піренокаетовою плямистістю листя (*Pyrenochaeta glycines*), ризоктоніозом повітря, листя, та павутинним фітофторозом (*Rhizoctonia solani*), іржею (*Phakopsora pachyrhizi*), лишайником (*Sphaceloma glycines*), плямистістю листя через стемфіліоз (*Stemphylium botryosum*), мішенеподібною плямистістю (*Corynespora cassiicola*).

грибковим захворюванням на коріннях та стебловій основі, обумовленим, наприклад, чорною кореневою гниллю (*Calonectria crotalariae*), вугільною гниллю (*Macrophomina phaseolina*), фузаріозною гниллю або зів'янням, кореневою гниллю, та стручковою та вузловою гниллю (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), кореневою гниллю *mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*), *neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfecta*), зів'янням, гниллю, руйнуванням стручка та стебла (*Diaporthe phaseolorum*), некрозом стебла (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*), фітофторозною гниллю (*Phytophthora megasperma*), коричневою гниллю стебла (*Phialophora gregata*), питіозною гниллю (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), коріневою гниллю різокотонії, руйнуванням стебла, та випріванням (*Rhizoctonia solani*), руйнуванням стебла пріллю (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероціальною південною гниллю (*Sclerotinia rolfsii*), кореневою гниллю тілевіопсиса (*Thielaviopsis basicola*).

Сполуки формули (I) також демонструють потенційний ефект зміцнення у рослин. Відповідно, вони можуть використовуватись для мобілізації захисту рослини проти нападу небажаних мікроорганізмів.

Речовини, які зміцнюють рослини (які індукують резистентність), в представленому контексті представляють собою речовини, здатні стимулювати захисну систему рослин, таким чином, що оброблені рослини, коли згодом їх інокулювали небажаними мікроорганізмами, розвивають високу ступінь резистентності до даних мікроорганізмів.

Крім того, в контексті представленого винаходу фізіологічні ефекти рослин включають наступні:

Толерантність до абіотичного стресу, яка включає толерантність до високих або низьких температур, толерантність до посухи та відновлення після стресу посухою, ефективність використання води (співвідношення до зменшеного споживання води), толерантність до поведі, толерантність до озонного стресу та УФ, толерантність по відношенню до хімічних речовин, таких як важкі метали, солі, пестициди, тощо.

Толерантність до біотичного стресу, яка включає підвищену резистентність до грибів та підвищену резистентність по відношенню до нематод, вірусів та бактерій. В контексті представленого винаходу, толерантність до біотичного стресу переважно включає підвищену резистентність до грибів та підвищену резистентність по відношенню до нематод.

Підвищена рослинна міцність, яка включає здоров'я рослина / якість рослини та міцність насіння, зменшене відставання підростку, покращене проростання, підвищене відновлення після періодів стресу, покращену пігментацію (наприклад, вміст хлорофілу, ефекти прозеленення, тощо) та покращену фотосинтетичну ефективність.

В представленому випадку, небажані мікроорганізми слід розуміти як значення фітопатогенних грибів, бактерій та вірусів. Речовини відповідно до винаходу можуть, таким чином, використовуватись для захисту рослин від нападів шкідливих патогенів, зазначені для певного періоду часу після обробки. Період часу, протягом якого забезпечується захист *protection*, як правило, знаходиться в діапазоні приблизно від 1 до 10 днів, переважно - від 1 до 7 днів, після обробки рослин активними сполуками.

Той факт, що активні сполуки добре переносяться рослинами в концентраціях, необхідних для контролю за захворюванням рослини, робить можливим обробку частин рослини над землею, °F матеріалу розмноження рослин та насіння, та ґрунту.

В такому контексті, активні сполуки відповідно до винаходу можуть використовуватись особливо успішно в контролі за захворюванням зернових культур, таких як, наприклад, видів *Ruscinia*, та захворюваннями у виноградарстві та у вирощуванні фруктів та овочів, таких як,

наприклад, види *Botrytis*, *Venturia* або *Alternaria*.

Активні сполуки відповідно до винаходу також є прийнятними для підвищення врожайності сільськогосподарських культур. Крім того, вони мають більш низьку токсичність та добре переносяться рослинами.

Всі рослини та частини рослини можуть бути оброблені відповідно до винаходу. Рослини, як мається на увазі в даному документі, означають всі рослини та популяції рослин, такі як бажані та небажані дикі рослини або сільськогосподарські культурні рослини (включаючи сільськогосподарські культурні рослини, які зустрічаються в природі). Сільськогосподарські культурні рослини можуть представляти собою рослини, які можуть бути отримані з використанням способів загальноприйнятого вирощування та оптимізації або з використанням способів біотехнологічного та генетичного інженерінгу або комбінацій даних способів, включаючи трансгенні рослини, та, включаючи сорти культурних рослин, які є захищеними та не захищеними правами селекціонерів. Частини рослини, як мається на увазі, означають всі частини та органи рослин над та під землею, такі як паросток, листок, квітка та корінь, приклади яких включають листя, голки, плодоніжки, стебла, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, та також коріння, бульби та кореневища. Частини рослин також включають матеріал, який збирається, та вегетативний та генеративний матеріал для розмноження, наприклад, живці, бульби, кореневища, скинуті плоди та насіння.

Рослини, які можуть бути оброблені відповідно до винаходу, включають наступні: бавовник, льон, винограду лоза, фрукти, овочі, такі як *Rosaceae* sp. (наприклад, зерняткові плоди, такі як яблука та груші, а також кісточкові плоди, такі як абрикоси, вишня, мигдаль та персики, соковиті плоди, такі як полуниця), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (наприклад, бананові дерева та плантації), *Rubiaceae* sp. (наприклад, кава), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (наприклад, лимони, апельсини та грейпфрут); *Solanaceae* sp. (наприклад, помідори), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (наприклад, салат), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp. (наприклад, огірок), *Alliaceae* sp. (наприклад, цибуля лука, цибуля), *Papilionaceae* sp. (наприклад, горох); основні сільськогосподарські культурні рослини, такі як *Gramineae* sp. (наприклад, кукурудза, дернові, зернові культури, такі як пшениця, жито, рис, ячмінь, овес, просо та тритикале), *Asteraceae* sp. (наприклад, соняшник), *Brassicaceae* sp. (наприклад, біла капуста, червона капуста, броколі, цвітна капуста, брюссельська капуста, пакхвой, кольрабі, редис, олійний ріпак, гірчиця, хрін та крес), *Fabaceae* sp. (наприклад, квасоля, арахіс), *Papilionaceae* sp. (наприклад, соєві боби), *Solanaceae* sp. (наприклад, картопля), *Chenopodiaceae* sp. (наприклад, цукровий буряк, кормовий буряк, листовий буряк, буряк); корисні рослини та декоративні рослини для садів та лісів; та генетично модифіковані сорти кожної з даних рослин.

Антимікозна активність

Крім того, сполуки формули (I) за винаходом також демонструють дуже гарні антимікозні ефекти. Вони демонструють дуже широкий спектр антимікозної активності, зокрема по відношенню до дерматофітів та дріжджів, плісняв та двофазних грибів, (наприклад по відношенню до видів *Candida*, таких як *Candida albicans*, *Candida glabrata*), та *Epidermophyton floccosum*, видів *Aspergillus*, таких як *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, видів *Trichophyton*, таких як *Trichophyton mentagrophytes*, видів *Microsporon*, таких як *Microsporon canis* та *M. audouinii*. Перелік даних грибів, жодним чином, не являє собою обмеження охопленого мітотичного спектру, та являє собою тільки ілюстративний характер.

Активні інгредієнти формули (I) за винаходом можуть, таким чином, використовувати як в медичному, так і немедичному застосуваннях.

Мікотоксини

Крім того, сполуки формули (I) можуть знижувати вміст мікотоксину в збірному матеріалі, та продуктах та кормах, які отримують з нього. Мікотоксини включають, зокрема, але не виключно, наступні: деоксиніваленол (DON), ніваленол, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, T2- та HT2-токсин, фумонізиди, зеараленон, моніліформін, фузарин, діацетоксискірпенол (DAS), беауверіцин, енніатін, фузаропроліферин, фузаренол, охратоксини, патулін, алкалоїди споринні та афлатоксини, які можуть продукуватися, наприклад, наступними грибами: *Fusarium* spec., такими як *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinatum*, *F. verticillioides* тощо, та також *Aspergillus* spec., такими як *A. flavus*, *A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, *Penicillium* spec., такими як *P. verrucosum*, *P. viridicatum*, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P. claviforme*,

P. roqueforti, *Claviceps* spec., такими як, *C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, *Stachybotrys* spec. та іншими.

Захист матеріалу

5 Сполуки формули (I) також можуть використовуватись в захисті матеріалів, для захисту промислових матеріалів від нападу та знищення фітопатогенними грибами.

Крім того, сполуки формули (I) можуть використовуватись як композиції для захисту проти обростання, самостійно або в комбінаціях з іншими активними інгредієнтами.

10 Промислові матеріали в представленому контексті, як мається на увазі, означають неживі матеріали, які отримують для використання в промисловості. Наприклад, промислові матеріали, які повинні бути захищені композиціями за винаходом від мікробного пошкодження або руйнування можуть представляти собою адгезиви, клеї, папір, шпалери та дошку/картон, текстиль, килими, шкіру, дерево, волокна та тканини, фарби та вироби з пластмаси, мастильні матеріали охолодження та інші матеріали, які можуть бути заражені або знищені мікроорганізмами. В межах обсягу матеріалів, які потребують захисту також зазначеними

15 можуть бути частини виробничих підприємств та будівель, наприклад, контур циркуляції охолоджуючої води, системи охолодження та опалення та установи для вентиляції та кондиціонування повітря, які можуть бути пошкодженими через розповсюдження мікроорганізмів. Промислові матеріали в межах обсягу представленого винаходу переважно включають адгезиви, клейстери, папір та картки, шкіру, дерево, фарби, мастильні матеріали охолодження та рідини для теплопередачі, більш переважно деревину.

20

Сполуки формули (I) можуть запобігати несприятливим наслідкам, таким як гниття, розкладання, обезбарвлення, освітлення кольору або формування цвілі.

У випадку обробки деревини сполуки формули (I) також можуть використовуватись проти грибкових захворювань, які піддаються росту на деревині або всередині неї. Термін "деревина" означає всі типи деревних порід, та всі типи обробки даного деревного матеріалу, призначеного для будівництва, наприклад, масивна деревина, деревина з високою щільністю, ламінована деревина та фанера. Спосіб обробки деревини відповідно до винаходу головним чином полягає у контактуванні композиції відповідно до винаходу; це включає, наприклад, безпосереднє застосування, розпилення, занурення, впорскування або будь-який інший прийнятний спосіб.

25

30 Крім того, сполуки формули (I) можуть використовуватись для захисту об'єктів, які контактують із солоною водою або слабомінералізованою водою, зокрема, корпусами, екранами, мережами, будівлями, причалами та системами сигналізації, від забруднення.

Сполуки формули (I) також можуть використовуватись для захисту товарів, які зберігаються на складах. Товари, які зберігаються на складах, як мається на увазі, означають природні речовини рослинного або тваринного походження або їх перероблені продукти, які мають природне походження, та для яких потрібним є довгостроковий захист. Товари рослинного походження, які зберігаються на складах, наприклад, рослини або частини рослини, такі як стебла, листя, бульби, насіння, плоди, зерна, можуть бути захищені свіжозібраними або після обробки шляхом (попереднього) сушіння, зволоження, подрібнення, шліфування, пресування або обсмажування. Товари, які зберігаються на складах також включають деревину, як неперероблену, таку як будівельну деревину, електричні стовпи та бар'єри, або в формі кінцевих продуктів, таких як меблі. Товари тваринного походження, які зберігаються на складах, представляють собою, наприклад, цільні шкіри, шкіру, хутра та волосся. Композиції за винаходом можуть запобігати несприятливим наслідкам, таким як гниття, розкладання, обезбарвлення, освітлення кольору або формування цвілі.

35

40

45

Мікроорганізми, здатні руйнувати або пошкоджувати промислові матеріали, включають, наприклад, бактерії, грибки, дріжджі, водорості та слизові організми. Сполуки формули (I) переважно діють проти грибків, особливо цвілі, обезбарвлення деревни грибками та руйнування деревини грибками (аскоміцетами, базидіоміцетами, детероміцетами та зигоміцетатами), та проти слизових організмів та водоростей. Приклади включають мікроорганізми наступних родів: *Alternaria*, такого як *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, такого як *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, такого як *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, такого як *Coniophora puetana*; *Lentinus*, такого як *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, такого як *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, такого як *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, такого як *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, такого як *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, такого як *Trichoderma viride*; *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. та *Tyromyces* spp., *Cladosporium* spp., *Paecilomyces* spp. *Mucor* spp., *Escherichia*, такого як *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, такого як *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, такого як *Staphylococcus aureus*, *Candida* spp. та *Saccharomyces* spp., такого як *Saccharomyces cerevisiae*.

50

55

60

Композиції

Представлений винахід, крім того, стосується композиції для контролю за небажаними мікроорганізмами, яка містить, щонайменше одну зі сполук формули (I). Вони переважно представляють собою фунгіцидні композиції, які містять сільськогосподарсько прийнятні допоміжні речовини, розчинники, носії, поверхнево-активні речовини або наповнювачі. Термін "композиції" охоплює агрохімічні композиції.

Відповідно до винаходу, носій представляє собою природну або синтетичну, органічну або неорганічну речовину, з якою активні інгредієнти змішуються або об'єднуються для кращого застосування, зокрема, для застосування на рослинах, частинах рослин або насінні. Носій, який може бути твердим або рідким, як правило, є інертним та повинен бути прийнятним для використання в сільському господарстві.

Використовувані тверді носії включають, наприклад, солі амонію та натуральну кам'яне борошно, таке як каоліни, глини, тальк, крейда, кварц, аттапульгіт, монтморіллоніт або діатомова земля та синтетичні кам'яні борошна, такі як дрібнодисперсні кремнезем, оксид алюмінію та силікати; використовувані тверді носії для гранул включають, наприклад, подрібнені та фракціоновані природні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт та доломіт, та також синтетичні гранули з неорганічного та органічного борошна та гранули з органічного матеріалу, такого як папір, тирса, кокосові шкарлупи, кукурудзяні качани та тютюнові стебла; використовувані емульгатори та/або піноутворювачі включають, наприклад, неіонні та аніонні емульгатори, такі як складні ефіри поліоксіетиленових жирних кислот, прості ефіри поліоксіетиленових жирних спиртів, наприклад, прості ефіри алкіларилполігліколю, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, та також протеїнові гідролізати; прийнятними диспергаторами є неіонні та/або іонні речовини, наприклад, з класів простих ефірів спирт-POE та/або -POP, складних ефірів кислота та/або POP POE, простих ефірів алкіларил та/або POP POE, жирних та/або POP POE аддуктів, POE- та/або POP-поліоліольних похідних, POE- та/або POP-сорбітанових або -цукрових аддуктів, алкіл або арилсульфатів, алкіл- або арилсульфонатів та алкіл- або арилфосфатів або відповідних аддуктів PO-простий ефір. До того ж прийнятними є оліго- або полімери, наприклад, ті, які отримують з вінілових мономерів, з акрилової кислоти, з EO та/або PO самостійно або в комбінації з, наприклад, (полі)спиртами або (полі)амінами. Можливим також є використовувати лігнін та його похідні сульфонові кислоти, немодифіковані та модифіковані целюлози, ароматичні та/або аліфатичні сульфокислоти, а також їхні аддукти з формальдегідом.

Активні інгредієнти можуть бути перетворені в загальноприйнятні композиції, такі як розчини, емульсії, змочувані порошки, суспензії на водній та олійній основі, порошки, пил, пасти, розчинні порошки, розчинні гранули, гранули для рівномірного розподілення, суспоемульсійні концентрати, просочені активним інгредієнтом натуральні продукти, просочені активним інгредієнтом синтетичні речовини, мінеральні добрива та також мікрокапсулювання в полімерних речовинах.

Активні інгредієнти можуть бути нанесені як такі у вигляді їх композицій або отриманих з них форм застосування, таких як готові до використання розчини, емульсії, суспензії на водній або на олійній основі, порошки, змочувані порошки, пасти, розчинні порошки, пил, розчинні гранули, гранули для рівномірного розподілення, суспоемульсійні концентрати, просочені активним інгредієнтом натуральні продукти, просочені активним інгредієнтом синтетичні речовини, мінеральні добрива, та також мікрокапсулювання в полімерних речовинах. Застосування здійснюють загальноприйнятим способом, наприклад, поливаючи, розпилюючи, дрібнодисперсно розбризкуючи, рівномірного розподіляючи, опудрюючи, спінуючи, намазуючи та аналогічним чином. Можливими також є розподіляти активні інгредієнти, застосовуючи спосіб наднизького об'єму або впорскувати композицію активного інгредієнта / сам активний інгредієнт у ґрунт. Можливим також є обробляти насіння рослин.

Вказані композиції можуть бути одержані за добре відомим способом, як таким, наприклад, шляхом змішування активних інгредієнтів з щонайменше одним загальноприйнятим наповнювачем, розчинником або розріджувачем, емульгатором, диспергатором та/або зв'язуючою речовиною або фіксуєчим агентом, зволожуючим агентом, водовідштовхуючим агентом, у випадку необхідності, сикативними агентами та УФ стабілізаторами, та, у випадку необхідності, барвниками та пігментами, протиспінуючими засобами, консервантами, вторинними загусниками, клейкими речовинами, гіберелінами та також іншими допоміжними речовинами для обробки.

Представлений винахід включає не тільки композиції, які є вже готовими до використання та можуть бути розподілені за допомогою прийнятного апарату на рослинах або насінні, але також комерційні концентрати, які перед використанням слід розбавити водою.

Сполуки формули (I) можуть бути присутніми як такі або у їх (комерційних) композиціях та в

формах застосування, які отримують з даних композицій як суміш з іншими (відомими) активними інгредієнтами, такими як інсектициди, аттрактанти, стерилізатори, бактерициди, акарициди, нематоциди, фунгіциди, регулятори росту, гербіциди, добрива, захисні речовини та/або семіохімічні речовини.

5 Використовувані допоміжні речовини можуть представляти собою такі речовини, які є прийнятними для передачі окремих властивостей самій композиції та/або препаратам, отриманим з неї (наприклад, розпилення рідин, обеззаражування насіння), такі як певні технічні властивості та/або специфічні біологічні властивості. Типові допоміжні речовини включають: наповнювачі, розчинники та носії.

10 Прийнятними наповнювачами є, наприклад, вода, полярні та неполярні органічні хімічні рідини, наприклад, з класів ароматичних та неароматичних вуглеводнів (таких як парафіни, алкілбензоли, алкілнафталіни, хлорбензоли), спиртів та поліолів (які також можуть бути необов'язково також заміщеними, етерифікованими та/або естерифіковані), кетонів (таких як ацетон, циклогексанон), складних ефірів (включаючи жири та олії) та (полі)простих ефірів, незаміщених та заміщених амінів, амідів, лактамів (таких як N-алкілпіролідони) та лактонів, сульфонів та сульфоксидів (таких як диметилсульфоксид).

Зріджені газоподібні наповнювачі або носії, як маєтсья на увазі, означають рідини, які є газоподібними при стандартній температурі та стандартному тиску, наприклад, аерозольні пропеленти, такі як галогеновані вуглеводні, або ще бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю.

20 В композиціях можливим є використовувати агенти для підвищення клейкості, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та синтетичні полімери у вигляді порошоків, гранул або латексів, таких як аравійська камедь, полівініловий спирт та полівінілацетат, або також природні фосфоліпіди, такі як цефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Крім того, добавки можуть представляти собою мінеральні та рослинні олії.

25 Якщо використовуваний наповнювач представляє собою воду, то можливим також є використовувати, наприклад, органічні розчинники як допоміжні розчинники. Використовувані рідкі розчинники в основному представляють собою: ароматичні вуглеводні, такі як ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метилехлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, петролейні фракції, спирти, такі як бутанол або гліколь та їх прості ефіри, та складні ефіри, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, такі як диметилформамід і диметилсульфоксид, або також вода.

35 Композиції, які включають сполуки формули (I), можуть додатково містити додаткові компоненти, наприклад, поверхнево-активні речовини. Прийнятні поверхнево-активні речовини представляють собою емульгатори та/або піноутворювачі, диспергатори або зволожуючі агенти, які мають іонні або неіонні властивості, або суміші даних поверхнево-активних речовин. Їх приклади включають солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової кислоти або нафталінсульфонової кислоти, поліконденсати етиленоксиду з жирними спиртами, або жирними кислотами, або жирними амінами, заміщені феноли (переважно алкілфеноли або арилфеноли), солі сульфосукцинових складних ефірів, похідні таурину (переважно алкілтаурати), фосфорні складні ефіри поліетоксильованих спиртів або фенолів, жирні складні ефіри поліолів, та похідні сполук, які містять сульфати, сульфонати та фосфати, наприклад, прості ефіри алкіларилполігліколя, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, протеїнові гідролізати, лігносульфітові відпрацьовані розчини та метилцелюлозу. Присутність поверхнево-активної речовини є необхідною, один з активних інгредієнтів та/або один з інертних носіїв є нерозчинним у воді, та коли ефективним є застосування у воді. Частка поверхнево-активних речовин становить від 5 до 40 відсотків за масою композиції за винаходом.

50 Можливим є використовувати барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану та прусський блакитний, та органічні барвники, такі як алізарінові барвники, або барвники та металофталоціанінові барвники, а також мікроелементи, таких як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

55 Додаткові добавки можуть представляти собою ароматизатори, мінеральні або рослинні, необов'язково модифіковані олії, воски та поживні речовини (включаючи мікроелементи), такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Додаткові компоненти можуть представляти собою стабілізатори, такі як холодні стабілізатори, консерванти, антиоксиданти, легкі стабілізатори або інші агенти, які покращують хімічну та/або фізичну стабільність.

60 У випадку необхідності, присутніми також можуть бути інші додаткові компоненти,

наприклад, захисні колоїди, зв'язуючі речовини, адгезиви, загусники, тиксотропні речовини, пенетранти, стабілізатори, комплексоутворюючі агенти, складні форми. Загалом, активні інгредієнти можуть комбінуватися з будь-якою твердою або рідкою добавкою, яка загальноприйнято використовується для цілей формулювання.

5 Композиції, як правило, містять від 0,05 до 99 % за масою, від 0,01 до 98 % за масою, переважно від 0,1 до 95 % за масою, більш переважно від 0,5 до 90 % активного інгредієнта, найбільш переважно від 10 до 70 відсотків за масою.

Композиції, описані вище, можуть використовуватись для контролю за небажаними мікроорганізмами, де композиції, які містять сполуки формули (I), застосовуються до 10 мікроорганізмів та/або їх середовища існування.

Обробка насіння

Винахід, крім того, включає спосіб обробки насіння.

Наступний аспект представленого винаходу стосується, зокрема, насіння (сплячого, попередньо обробленого, попередньо пророщеного або навіть з виникненням коріння та листя), 15 обробленого, щонайменше, однією зі сполук формули (I). Насіння за винаходом використовують у способах захисту насіння та виникнення рослин із насіння з фітопатогенними шкідливими грибами. В даних способах, використовується насіння, оброблене, щонайменше, одним активним інгредієнтом за винаходом.

Сполуки формули (I) є також прийнятними для обробки насіння та молодих саджанців. 20 Велика частина пошкоджень сільськогосподарських культурних рослин, викликаних шкідливими організмами, ініціюється інфікуванням насіння перед посівом або після проростання рослини. Дана фаза є особливо критичною оскільки корені та паростоки зростаючої рослини є особливо чутливими, та навіть невеликі пошкодження можуть в результаті призвести до загибелі рослини. Відповідно, існує велика зацікавленість щодо захисту насіння та проростаючої рослини шляхом 25 застосування відповідних композицій.

Крім того, бажаним є оптимізувати кількість використовуваного активного інгредієнта, таким чином, щоб забезпечити найкращий можливий захист насіння, проростаючих рослин та вирощених саджанців від нападу фітопатогенних грибів, але не завдаючи шкоди самим 30 рослинам використовуваним активним інгредієнтом. Зокрема, способи обробки насіння також повинні приймати до уваги внутрішні фенотипи трансгенних рослин для того, щоб досягти оптимального захисту насіння та проростаючої рослини з мінімумом композиції для захисту сільськогосподарських культур, яка використовується.

Представлений винахід, таким чином, також стосується способу захисту насіння, проростаючих рослин та вирощених саджанців від нападу шкідників тварин та/або 35 фітопатогенних шкідливих мікроорганізмів шляхом обробки насіння композицією за винаходом. Винахід також стосується застосування композиції відповідно до винаходу для обробки насіння для захисту насіння, проростаючих рослин та вирощених саджанців від шкідників тварин та/або фітопатогенних мікроорганізмів. Винахід, крім того, стосується насіння, яке оброблялось композицією за винаходом для захисту від шкідників тварин та/або фітопатогенних 40 мікроорганізмів.

Однією з переваг представленого винаходу є те, що обробка насіння з використанням даних композицій не тільки захищає насіння саме по собі, але також і отримані в результаті рослини після появи сходів від виникнення шкідників тварин та/або фітопатогенних шкідливих мікроорганізмів. Таким чином, безпосередня обробка сільськогосподарських культур під час 45 посіву або незабаром після цього захищає рослини, а також обробка насіння перед посівом. Аналогічним чином, вважається переважним те, що активні інгредієнти або композиції за винаходом можуть використовуватись, особливо, для трансгенного насіння, у випадку якого рослина, яка виростає з даного насіння, здатна експресувати протеїн, який діє проти шкідників, гербіцидних пошкоджень або абіотичного стресу. Обробка такого насіння активними 50 інгредієнтами або композиціями за винаходом, наприклад, інсектицидним протеїном, може в результаті призвести до контролю деяких шкідників. Неочікувано, що в даному випадку спостерігається додатковий синергетичний ефект, який додатково підвищує ефективність захисту від нападу шкідників, мікроорганізмів, бур'янів або абіотичного стресу.

Сполуки формули (I) є прийнятними для захисту насіння будь-якого сорту рослин, який 55 використовується в сільському господарстві, в теплиці, в лісах або в садівництві. Зокрема, насіння представляє собою зернові культури (такі як пшениця, ячмінь, жито, просо та овес), олійний ріпак, кукурудзу, бавовник, сою, рис, картоплю, соняшник, квасолю, каву, буряк (наприклад, цукровий буряк та кормовий буряк), арахіс, овочі (такі як помідори, огірки, цибуля та салат), газонні та декоративні рослини. Особливе значення має обробка насіння пшениці, сої, 60 олійного ріпаку, кукурудзи та рису.

Як також описується нижче, особливе значення має обробка трансгенного насіння активними інгредієнтами або композиціями за винаходом. Це стосується насіння рослин, яке містить щонайменше один гетерологічний ген, який дозволяє експресію поліпептида або протеїна, наприклад, який демонструє інсектицидні властивості. Дані гетерологічні гени в трансгенному насінні можуть походити, наприклад, з мікроорганізмів виду *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* або *Gliocladium*. Дані гетерологічні гени переважно походять з *Bacillus sp.*, у випадку якого генний продукт є ефективним проти кукурудзяного метелика та/або західного кукурудзяного жука. Особливо переважно, гетерологічні гени походять з *Bacillus thuringiensis*.

В контексті представленого винаходу, композиція за винаходом застосовується до насіння або самостійно, або в прийнятній композиції. Переважно, насіння обробляють у стані, в якому воно є достатньо стабільним, щоб не з'являлись пошкодження в процесі обробки. Загалом, насіння можуть обробляти в будь-який час між збором урожаю та деяким часом після посіву. Загальноприйнятним є використовувати насіння, яке було відокремлено від рослини та визволене від початків, лушпиння, плідоніжок, покриттів, волосків або свіжих плодів. Наприклад, можливим є використовувати насіння, яке було зібрано, очищено та висушено до вмісту вологи менше, ніж 15 % за масою. Альтернативно, можливими також є використовувати насіння, яке після сушіння, наприклад, обробляли водою, та потім знову висувували, або насіння щойно після праймінгу, або насіння, яке зберігалось в умовах після первинної обробки або попередньо проросле насіння, або насіння, висіяне в лотки розпліднику, на стрічки або папір.

При обробці насіння, як правило, слід гарантувати, що кількість композиції за винаходом, яка застосовується до насіння, та/або кількість додаткових добавок, вибирається таким чином, що проростання насіння не порушується, або що отримана в результаті рослина не є пошкодженою. Це повинно бути забезпечено, зокрема, у випадку активних інгредієнтів, які можуть демонструвати фітотоксичні ефекти при певних нормах застосування.

Сполуки формули (I) можуть застосовувати безпосередньо, тобто без будь-яких інших компонентів та без розбавлення. Загалом, переважним є застосовувати композиції до насіння у формі прийнятної композиції. Прийнятні композиції та способи обробки насіння є відомими кваліфікованому фахівцю в даній галузі. Сполуки формули (I) можуть бути перетворені в загальноприйнятні композиції, які стосуються застосування до насіння, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, дрібнодисперсні суспензії або комбіновані з іншими композиціями покриття для насіння, такими як плівкоутворюючі матеріали, пелетуючі матеріали, дрібнодисперсне залізо або інші металеві порошки, гранули, матеріал покриття для інактивованого насіння, та також ULV препарати.

Дані препарати отримують за відомим способом, шляхом змішування активних інгредієнтів або комбінацій активних інгредієнтів із загальноприйнятими добавками, наприклад, загальноприйнятими наповнювачами та розчинниками або розріджувачами, барвниками, зволожуючими агентами, диспергаторами, емульгаторами, протиспінюючими засобами, консервантами, вторинними загусниками, адгезивами, гіберелінами, та також водою.

Використовувані барвники, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всіма барвниками, які є загальноприйнятими для таких цілей. Можливим є використовувати або пігменти, які є помірно розчинними у воді, або барвники, які є розчинними у воді. Приклади включають барвники, які є відомими під назвами родамін В, С.І. пігмент червоний 112 та С.І. розчинний червоний 1.

Використовувані зволожуючі агенти, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всіма речовинами, які сприяють зволоженню, та які звичайно використовуються для формулювання активних агрохімічних інгредієнтів. Перевагу у використанні мають алкілнафталінсульфонати, такі як діізопропіл- або діізобутилнафталінсульфонати.

Використовувані диспергатори та/або емульгатори, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всі неіонні, аніонні та катіонні диспергатори, які традиційно використовуються для формулювання активних агрохімічних інгредієнтів. Перевагу у використанні мають неіонні або аніонні диспергатори або суміші неіонних або аніонних диспергаторів. Використовувані неіонні диспергатори включають, зокрема, блок-полімери етиленоксид/пропіленоксид, алкілфенол-полігліколеві прості ефіри та тристирилфенол-полігліколеві прості ефіри, та їх фосфатовані або сульфатовані похідні. Прийнятними аніонними диспергаторами є, зокрема, лігносульфонати, солі поліакрилової кислоти та конденсати арилсульфонат/формальдегід.

Протиспінюючі засоби, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування

насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всі речовини, які пригнічують піноутворення, які загальноприйнято використовуються для формулювання активних агрохімічних інгредієнтів. Силіконові протиспінюючі засоби та стеарат магнію можуть мати перевагу у використанні.

5 Консерванти, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всі речовини, використовуванні для таких цілей в агрохімічних композиціях. Приклади включають дихлорфен та напівацеталь формальдегіда бензилового спирта.

10 Вторинні загусники, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всі речовини, використовуванні для таких цілей в агрохімічних композиціях. Переважні приклади включають похідні целюлози, похідні акрилової кислоти, ксантан, модифіковані глини та дрібнодисперсійний кремнезем.

Адгезиви, які можуть бути присутніми в композиціях для обеззаражування насіння, прийнятні для використання відповідно до винаходу, є всі загальноприйняті зв'язуючі речовини, які використовуються в продуктах для переробки насіння. Переважні приклади включають полівінілпіролідон, полівінілацетат, полівініловий спирт та тилозу.

Композиції для застосування до насіння, які застосовуються відповідно до винаходу, можуть використовуватись для обробки широкого різноманіття різних видів насіння, або безпосередньо, або після попереднього розбавлення з водою. Наприклад, концентрати або препарати, отримані з них шляхом розведення водою, можуть бути використані для обробки насіння зернових культур, таких як пшениця, ячмінь, жито, овес та тритикале, а також насіння кукурудзи, сої, рису, олійного рапсу, гороху, бобів, бавовника, соняшників та буряків, або ж широкого різноманіття різного насіння овочів. Композиції, прийнятні для використання відповідно до винаходу, або їх розбавлені препарати, також можуть використовуватись для насіння трансгенних рослин. В цьому випадку додаткові синергетичні ефекти можуть також виникати при взаємодії з речовинами, утвореними шляхом експресії.

Для обробки насіння композиціями, прийнятними для використання відповідно до винаходу, або препаратами, отриманими з них шляхом додавання води, всі одиниці змішування, прийнятні для використання, зазвичай використовують для застосування до насіння. Зокрема, процедура в застосуванні до насіння полягає в тому, щоб помістити насіння в змішувач, додавати певну необхідну кількість препаратів або, як таких, або після попереднього розбавлення водою, та змішувати все, доки всі застосовувані композиції не розподіляються однорідно на насінні. У випадку необхідності, з наступною операцією висушування.

35 Норма застосування композицій, прийнятих для використання відповідно до винаходу, може варіюватися у відносно широкому діапазоні. Регулюється конкретний вміст активних інгредієнтів в композиціях та насінні. Норми застосування кожного окремого активного інгредієнта становить, як правило від 0,001 до 15 г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 5 г на кілограм насіння.

ГМО

40 Як вже було зазначено вище, можливим є обробити всі рослини та їх частини відповідно до винаходу. В переважному варіанті здійснення обробляють дикоростучі види рослин та сорти культурних рослин, або ті, які отримують з використанням традиційних способів біологічного розмноження, такі як схрещення або злиття протопластів, а також їх частин. В наступному переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, отримані з використанням способів генної інженерії, у випадку необхідності, в комбінації із звичайними способами (генетично модифікованими організмами) та їх частинами. Терміни "частини", або "частини рослин", або "рослинні частини" пояснюються вище. Більш переважно, рослини сортів культурних рослин, які є комерційно доступними або використовуються, обробляються відповідно до винаходу. Сорти культурних рослин, як мається на увазі, означають рослини, які мають нові властивості ("характеристики") та отримані шляхом звичайного розведення, мутагенезу або рекомбінантними способами ДНК. Вони можуть бути видами, сортами, біологічними типами або генотипами.

Спосіб обробки відповідно до винаходу можуть використовуватись в обробці генетично модифікованих організмів (ГМО), наприклад, рослин або насіння. Генетично модифіковані рослини (або трансгенні рослини) представляють собою рослини, гетерологічний ген яких був стабільно інтегрований в геном. Вираз "гетерологічний ген" фактично означає ген, який забезпечується або збирається поза рослини, та коли вводиться в ядерний, хлоропластичний або мітохондріальний геном дає трансформовану рослину з новими або покращеними агрономічними або іншими властивостями шляхом експресії протеїну або поліпептиду, що викликає зацікавленість, або шляхом даунрегуляції або сайленсинга іншого(их) гена(ів), які є

присутніми в рослині (використовуючи, наприклад, антисенсову технологію, технологію співсупресії, інтерференцію РНК – РНКі – технологію або мікроРНК – міРНК – технологію). Гетерологічний ген, який знаходиться в геномі, також називають трансгеном. Трансген, який визначається його конкретним місцем в геномі рослини, називають трансформацією або трансгенною подією.

Рослини та сорти культурних рослин, які переважно обробляються відповідно до винаходу, включають всі рослини, які мають генетичний матеріал, який несе особливо переважні, корисні ознаки для даних рослин (незалежно від того, чи отримані шляхом селекції та/або з використанням біотехнологічних засобів).

Рослини та сорти культурних рослин, які також переважно обробляються відповідно до винаходу, є стійкими до одного або декількох біотичних стресів, тобто зазначені рослини демонструють кращий захист від тваринних та мікробних шкідників, таких як нематоди, комахи, кліщі, фітопатогенні грибки, бактерії, віруси та/або віроїди.

Рослини та сорти культурних рослин, які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу представляють собою такі рослини, які є стійкими до одного або декількох абіотичних стресів. Умови абіотичного стресу можуть включати, наприклад, посуху, вплив холодної температури, тепловий вплив, осмотичний стрес, затоплення, підвищену солоність ґрунтів, збільшення мінеральних речовин, вплив озону, високий рівень освітлення, обмежена наявність поживних речовин азоту, обмежена доступність поживних фосфорних речовин, ухилення від тіні.

Рослини та сорти культурних рослин, які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою такі рослини, які характеризуються підвищеними характеристиками виходу. Підвищена врожайність в зазначених рослинах може бути результатом, наприклад, покращеної фізіології рослини, росту та розвитку рослин, таких як ефективність використання води, ефективність утримання води, покращення використання азоту, покращена асиміляція вуглецю, покращення фотосинтезу, підвищення ефективності проростання та прискореного дозрівання. Крім того, на врожай може впливати покращена архітектура рослини (в умовах стресу та за відсутності стресу), включаючи але не обмежуючись цим, раннє цвітіння, контроль за цвітінням для отримання гібридного насіння, дружність проростання розмір рослини, кількість інтернодій та відстань, ріст кореня, розмір насіння, розмір плоду, розмір стручка, кількість стручків або колосків, кількість насіння на стручок або колосок, маса насіння, підвищена наповненість насіння, зменшена дисемінація, зменшене розкриття стручка та стійкість до полягання. Крім того, ознаки виходу включають склад насіння, такий як вміст вуглеводів, та склад, наприклад, бавовни або крохмалю, вміст протеїну, вміст та склад олії, харчова цінність, зменшення непоживних сполук, покращена технологічність та краща стабільність при зберіганні.

Рослини, які можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою гібридні рослини, які вже виражають характеристику гетерозису або гібридної сили, що, як правило, призводить до вищої врожайності, сили, здоров'я та стійкості до біотичних та абіотичних стресів).

Рослини або сорти культурних рослин (отримані з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою рослини, стійкі до гербіциду, тобто рослини, зроблені стійкими до одного або декількох зазначених гербіцидів. Такі рослини можуть бути отримані або за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють таку гербіцидну толерантність.

Рослини або сорти культурних рослин (отримані з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою стійкі до комах трансгенні рослини, тобто рослини, зроблені стійкими до нападу певних цільових комах. Такі рослини можуть отримувати за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють таку інсектицидну стійкість.

Рослини або сорти культурних рослин (отримані з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, є толерантними до абіотичних стресів. Такі рослини можуть отримувати за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють таку стресову стійкість.

Рослини або сорти культурних рослин (отримані з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, показують змінену кількість, якість та/або стабільність при зберіганні

зібраного продукту та/або змінені властивості конкретних інгредієнтів зібраного продукту.

Рослини або сорти культурних рослин (які можуть отримувати з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою рослини, такий як рослини бавовника, зі зміненими характеристиками волокон. Такі рослини можуть отримувати за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють такі характеристики зміненого волокна.

Рослини або сорти культурних рослин (які можуть отримувати з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою рослини, такі як олійний ріпак або пов'язані з ним рослини Brassica, зі зміненими характеристиками олійного профілю. Такі рослини можуть отримувати за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють такі змінені характеристики олійного профілю.

Рослини або сорти культурних рослин (які можуть отримувати з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою рослини, такий як олійний ріпак або пов'язані з ним рослини Brassica, зі зміненими характеристиками руйнування насіння. Такі рослини можуть отримувати за рахунок генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутації, що поширюють такі змінені характеристики руйнування насіння, та включають рослини, такі як рослини олійного ріпаку з уповільненим або зменшеним руйнуванням насіння.

Рослини або сорти культурних рослин (які можуть отримувати з використанням рослинних біотехнологічних способів, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені відповідно до винаходу, представляють собою рослини, такий як рослини тютюну, зі зміненими посттрансляційними структурами модифікації протеїну.

Норми застосування

При використанні сполук формули (I), як фунгіцидів, норми застосування можуть варіюватися в межах відносно широкого діапазону, в залежності від виду застосування. Норма застосування активних інгредієнтів за винаходом становить

- у випадку обробки частин рослини, наприклад, листя: від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 10 до 1000 г/га, більш переважно від 20 до 200 г/га (у випадку застосування шляхом поливу або крапельної обробки, можливим навіть є зменшити норму застосування, зокрема, коли застосовують інертні субстрати, такі як мінеральна вата або перліт);

- у випадку обробки насіння: від 0,1 до 200 г на 100 кг насіння, переважно від 1 до 150 г на 100 кг насіння, більш переважно від 2,5 до 25 г на 100 кг насіння, навіть більш переважно від 2,5 до 12,5 г на 100 кг насіння;

- у випадку обробки ґрунту: від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 1 до 5000 г/га.

Дані норми застосування наводяться як приклад та не обмежуються цілими винаходами.

Наведені рослини можуть бути оброблені відповідно до винаходу особливо переважним способом з використанням сполук загальної формули (I) та/або сумішшю активних сполук відповідно до винаходу. Переважні діапазони, зазначені вище для активних сполук або сумішей також застосовуються для обробки даних рослин. Особливий акцент робиться на обробку рослин сполуками або сумішами конкретно зазначеними в представленому тексті.

Отримання та застосування активних сполук відповідно до винаходу мають бути більш повним чином пояснені з наступних прикладів, однак, вони не обмежуються ними.

Приклади отримання

Отримання та застосування активних інгредієнтів формули (I) за винаходом ілюструються прикладами, які слідує далі. Однак, винахід не обмежується даними прикладами.

Загальні зауваження: Якщо не зазначено інше, то всі стадії хроматографічної очистки та розділення здійснюють на силікагелі та застосовують градієнт розчинників від 0:100 етилацетат/циклогексан до 100:0 етилацетат/циклогексан.

Отримання сполуки формули (I-02)

Стадія 1

1-Хлор-5-(дифторметил)-2-метил-4-нітробензол

До розчину 3,0 г (15,03 ммоль, 1,0 екв.) 5-хлор-4-метил-2-нітробензальдегіда в 50 мл CHCl_3 додавали 2,42 г (30,06 ммоль, 2,0 екв.) діетиламіносірки трифторид (DAST) при 0 °C, та реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 12 годин. Після завершення реакції, суміш розбавляли розчином натрію карбонату та екстрагували CHCl_3 . Органічний шар промивали насиченим сольовим розчином, сушили над безводним сульфатом натрію, та розчинник видаляли при зниженому тиску. Сирий продукт чистили, застосовуючи силікагелеву колоночну хроматографію (100-200 меш, розчинник 5 % етилацетат/ петролейний ефір),

отримуючи 2,0 г 1-хлор-5-(дифторметил)-2-метил-4-нітробензолу.

Стадія 2

1-(Дифторметил)-5-(2-фторфенокси)-4-метил-2-нітробензол (VI-02)

До розчину, який перемішується, 500 мг (2,256 ммоль, 1,0 екв.) 1-хлор-5-(дифторметил)-2-метил-4-нітробензолу в 5 мл ДМФ при кімнатній температурі додавали 278 мг (2,48 ммоль, 1,1 екв.) 2-фторфенолу, 935 мг (6,769 ммоль, 3,0 екв.), та реакційну суміш нагрівали до 90 °С протягом 12 годин. Після завершення реакції, суміш розбавляли водою та екстрагували етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим сольовим розчином, сушили над безводним сульфатом натрію, та видаляли розчинник при зниженому тиску. Сиру речовину чистили, застосовуючи силікагелеву колоночну хроматографію (100-200 меш, розчинник 5 % етилацетат/ петролейний ефір), отримуючи 300 мг 1-(дифторметил)-5-(2-фторфенокси)-4-метил-2-нітробензолу.

Стадія 3

2-(Дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метиланілін (VIII-02)

До розчину 300 мг (1,01 ммоль, 1,0 екв.) 1-(дифторметил)-5-(2-фторфенокси)-4-метил-2-нітробензолу в EtOH (15 мл) при кімнатній температурі додавали 30 мг Pd/C, та суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 12 годин під тиском балонного водню. Після завершення, суміш фільтрували, розбавляли етилацетатом та екстрагували водою. Об'єднані органічними фази промивали насиченим сольовим розчином, сушили над безводним сульфатом натрію, та видаляли розчинник при зниженому тиску, отримуючи 250 мг сирого продукту, який використовували без додаткової очистки на наступній стадії.

Стадія 4

N'-[2-(Дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформамід (I-02)

Розчин, який перемішували, з 250 мг (0,94 ммоль, 1,0 екв.) 2-(дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метиланіліна в 5 мл триетил орто-форміату нагрівали до 120 °С протягом 1 години. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, з наступним додаванням 1,25 мл N-метилетиламіну в 15 мл дихлорметану та каталітичних кількостей паратолуолсульфонової кислоти. Суміш нагрівали до 55 °С протягом 2 годин. Після завершення реакції, її розбавляли водою та екстрагували ДХМ. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим сольовим розчином, сушили над безводним сульфатом натрію, та видаляли розчинник при зниженому тиску. Сирий продукт чистили, застосовуючи силікагелеву колоночну хроматографію (100-200 меш, 15 % етилацетат/петролейний ефір), отримуючи 100 мг N'-[2-(дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміда.

Отримання сполуки формули (I-04)

Стадія 1

4-Бром-2-(2-хлорфенокси)-1-метил-5-нітробензол (VI-04)

500 мг (2,14 ммоль) 1-бром-5-фтор-4-метил-2-нітробензол та 591 мг (4,27 ммоль) калію карбонату суспендували в 10 мл сухого ДМФ та нагрівали до 90 °С. До даного розчину додавали по краплям протягом 1 години розчин 275 мг (2,14 ммоль) 2-хлорфенолу в 10 мл сухого ДМФ. Реакція завершувалась через 2,5 години. Суміш концентрували при зниженому тиску, з наступним додаванням води та фільтруванням продукту, отримуючи 655 мг (80,5 %) 4-бром-2-(2-хлорфенокси)-1-метил-5-нітробензолу у вигляді жовтої твердої речовини.

Стадія 2

2-Бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метиланілін (VIII-04)

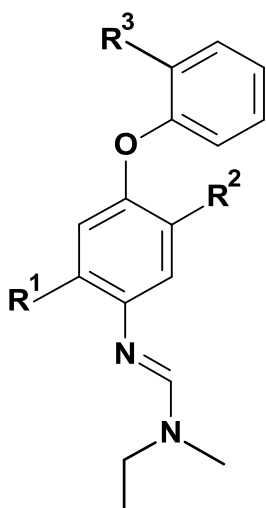
655 мг (1,9 ммоль) 4-бром-2-(2-хлорфенокси)-1-метил-5-нітробензолу розчиняли в 10 мл EtOH з наступним додаванням 2,2 г (9,6 ммоль) дигідрату дихлориду олова ($\text{SnCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$). Суміш кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 1 години, охолоджували до кімнатної температури, з наступним додаванням криги та корегуванням pH до 10 повільним додаванням натрію карбонату. Водну фазу екстрагували етилацетатом, органічну фазу сушили над MgSO_4 , потім концентрували в вакуумі, та сирий продукт хроматографували, застосовуючи Combiflash (40 г силікагелю, градієнт циклогексан/етилацетат). Отримували 345 мг 2-бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метиланіліну.

Стадія 3

N'-[2-Бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформамід (I-04)

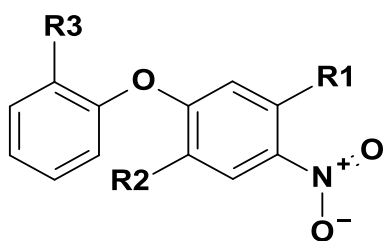
345 мг (1,1 ммоль) 2-бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метиланіліну та 191 мг (1,4 ммоль) N-(диметоксиметил)-N-метилетанаміну розчиняли в 10 мл сухого толуолу та нагрівали протягом 12 годин при 80 °С. Суміш охолоджували до кімнатної температури, концентрували при зниженому тиску та чистили застосовуючи хроматографію з використанням Combiflash (12 г силікагелю, розчинник: градієнт циклогексан/етилацетат), отримуючи 281 мг N'-[2-бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду.

Приклади



(I)

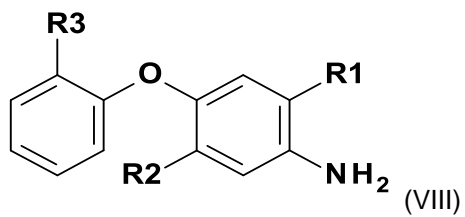
Пр. N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
I-01	Cl	Me	F	1,66 ^[a]
I-02	CHF ₂	Me	F	1,76 ^[a]
I-03	Br	Me	F	1,66 ^[a] ; 4,53 ^[b]
I-04	Br	Me	Cl	1,84 ^[a] ; 4,97 ^[b]
I-05	Cl	Me	Cl	1,58 ^[a]
I-06	Cl	Me	I	1,78 ^[a]
I-07	Br	Me	Br	1,81 ^[a]



(VI)

5

Пр. N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
VI-01	Cl	Me	F	4,21 ^[a] ; 4,17 ^[b]
VI-02	CHF ₂	Me	F	3,97 ^[a]
VI-03	Br	Me	F	4,26 ^[a]
VI-04	Br	Me	Cl	4,68 ^[a]
VI-05	Cl	Me	Cl	4,67 ^[a]
VI-06	Cl	Me	I	4,94 ^[a]
VI-07	Br	Me	Br	4,80 ^[a]



(VIII)

Пр. N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
VIII-01	Cl	Me	F	3,45[a]; 3,40[b]
VIII-02	CHF ₂	Me	F	
VIII-03	Br	Me	F	3,55[a]
VIII-04	Br	Me	Cl	3,53[b]
VIII-05	Cl	Me	Cl	3,85[a]
VIII-06	Cl	Me	I	4,23[a]
VIII-07	Br	Me	Br	4,14[a]

Вимірювання значень LogP проводилось відповідно до директиви ЕЕС 79/831 Додатку V.A8 з використанням ВЕРХ (високоєфективної рідинної хроматографії) на колонках з оберненою фазою, застосовуючи наступні способи:

^[a] Значення LogP визначають шляхом вимірювання РХ-УФ, в кислотному діапазоні, з 0,1 % мурашиною кислотою у воді та ацетонітрилом як елюентом (лінійний градієнт від 10 % ацетонітрилу до 95 % ацетонітрилу).

^[b] Значення LogP визначають шляхом вимірювання РХ-УФ, в нейтральному діапазоні, з 0,001 молярним розчином ацетату амонію у воді та ацетонітрилом як елюентом (лінійний градієнт від 10 % ацетонітрилу до 95 % ацетонітрилу).

Калібрування здійснювали з використанням алкан-2-онів з лінійним ланцюгом (з від 3 до 16 атомами вуглецю) з відомими значеннями LogP (вимірювання значень LogP з використанням часу утримання з лінійною інтерполяцією між наступними алканонами). Значення лямбда-макс визначали за допомогою УФ-спектрів від 200 нм до 400 нм та пікових значень хроматографічних сигналів.

Перелік ЯМР-пиків

Дані ¹H-ЯМР вибраних прикладів записуються у вигляді списків ¹H-ЯМР-пиків. Для кожного піка сигналу вказується значення δ в м.ч. та інтенсивність сигналу в круглих дужках. Між парами значення δ та інтенсивність сигналу ставлять точку з комою як роздільники.

Перелік пиків приклада має, таким чином, форму:

δ₁ (інтенсивність₁); δ₂ (інтенсивність₂);.....; δ_i (інтенсивність_i);.....; δ_n (інтенсивність_n)

Інтенсивність гострих сигналів корелює з висотою сигналів у друкованому вигляді спектру ЯМР в см та показує реальні співвідношення інтенсивності сигналу. З широких сигналів можуть бути показані деякі піки або середини сигналу та їх відносні інтенсивності у порівнянні з найбільш інтенсивним сигналом у спектрі.

Для калібрування хімічного зсуву для спектрів ¹H, використовується тетраметилсилан, та/або хімічний зсув використовуваного розчинника, зокрема, у випадку спектрів, які записували в ДМСО. Таким чином, в переліку ЯМР пиків, може бути присутнім пік тетраметилсилану, але не обов'язково.

Переліки пиків ¹H-ЯМР є аналогічними до класичних ¹H-ЯМР відбитків, та містять, таким чином, як правило, всі піки, які є переліченими в класичній ЯМР-інтерпретації.

Крім того, вони можуть показувати аналогічні класичні ¹H-ЯМР відбитки сигналів розчинників, стереоізомерів цільових сполук, які також є об'єктом винаходу, та/або піки домішок.

Для демонстрації сигналів сполуки в дельта-діапазоні розчинників та/або води звичайні піки розчинників, наприклад, піки ДМСО в ДМСО-_D6 та пік води, є показаними в наведених переліках ¹H-ЯМР пиків та, як правило, мають високу інтенсивність середнього значення.

Піки стереоізомерів цільових сполук та/або піки домішок зазвичай мають більш низьку інтенсивність середнього значення, ніж піки цільових сполук (наприклад, з чистотою > 90 %).

Такі стереоізомери та/або домішки можуть бути типовими для конкретного способу отримання. Таким чином їх піки можуть допомогти розпізнати відтворення нашого способу отримання з використанням "відбитків пальців побічних продуктів".

Експерт, який обчислює піки цільових сполук з використанням відомих способів (Mestrec, ACD-симуляція, але також з оціненими емпірично очікуваними значеннями), може відокремити піки цільових сполук, якщо необхідно, необов'язково, використовуючи фільтри для додаткової інтенсивності. Дане відокремлення було б подібним до відповідного вибору піку при класичній ¹H-ЯМР інтерпретації.

Крім того, деталі щодо опису ЯМР даних з переліками пиків ви знайдете в публікації "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" з Research Disclosure Database Number 564025.

Приклад I-01: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,750 (1,4); 7,637 (0,6); 7,386 (0,9); 7,379 (0,6); 7,373 (0,8); 7,368 (0,7); 7,361 (1,2); 7,357 (1,1); 7,352 (0,8); 7,350 (0,7); 7,339 (1,0); 7,333 (1,1); 7,170 (0,5); 7,157 (2,2); 7,151 (1,9); 7,143 (2,5); 7,138 (2,3); 7,132 (2,4); 7,126 (1,2); 7,120 (0,9); 7,107 (0,3); 6,958 (1,6); 6,937 (0,7); 6,907 (0,9); 6,900 (0,6); 6,895 (0,8); 6,883 (1,3); 6,867 (0,7); 6,861 (0,8); 6,850 (5,7); 3,446 (0,5); 3,429 (0,6); 3,376 (0,6); 3,359 (1,2); 3,340 (1,4); 3,328 (27,2); 2,999 (1,7); 2,926 (4,4); 2,525 (0,7); 2,512 (14,1); 2,507 (28,3); 2,503 (37,5); 2,498 (28,2); 2,494 (14,5); 2,130 (16,0); 1,161 (1,6); 1,144 (3,5); 1,127 (2,4); 0,008 (1,7); 0,000 (43,5); -0,009 (1,8)

Приклад I-02: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,894 (1,3); 7,779 (0,8); 7,399 (1,4); 7,392 (1,1); 7,386 (1,6); 7,374 (2,0); 7,371 (1,9); 7,365 (1,5); 7,352 (1,5); 7,346 (1,7); 7,305 (0,8); 7,261 (0,4); 7,185 (1,0); 7,166 (5,0); 7,161 (5,0); 7,148 (4,2); 7,123 (1,1); 7,039 (1,7); 7,026 (1,8); 6,982 (0,5); 6,905 (1,8); 6,889 (1,1); 6,852 (7,9); 3,903 (2,8); 3,636 (1,4); 3,448 (1,1); 3,432 (1,3); 3,397 (1,3); 3,380 (2,4); 3,363 (2,5); 3,321 (201,6); 3,283 (0,4); 3,174 (0,3); 3,163 (0,4); 3,018 (3,0); 2,929 (6,7); 2,670 (1,5); 2,506 (182,9); 2,502 (228,4); 2,497 (170,7); 2,335 (2,0); 2,328 (1,4); 2,209 (16,0); 1,249 (0,4); 1,234 (0,8); 1,168 (2,7); 1,151 (5,3); 1,133 (3,9); 1,110 (2,5); 0,977 (0,6); 0,961 (0,6); 0,000 (9,6)

Приклад I-03: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,737 (1,2); 7,620 (0,5); 7,384 (0,9); 7,378 (0,6); 7,372 (0,7); 7,367 (0,7); 7,360 (1,2); 7,356 (1,1); 7,351 (0,8); 7,337 (1,0); 7,331 (1,2); 7,172 (0,5); 7,159 (2,1); 7,154 (2,0); 7,145 (2,8); 7,142 (2,1); 7,139 (2,2); 7,135 (2,3); 7,127 (1,1); 7,122 (0,9); 6,987 (5,6); 6,956 (1,4); 6,932 (0,7); 6,912 (0,9); 6,905 (0,6); 6,900 (0,7); 6,888 (1,3); 6,872 (0,7); 6,867 (0,8); 3,445 (0,5); 3,429 (0,6); 3,375 (0,5); 3,359 (1,1); 3,342 (1,1); 3,316 (14,4); 2,999 (1,6); 2,931 (3,7); 2,524 (0,7); 2,511 (11,8); 2,506 (23,7); 2,502 (31,7); 2,498 (23,9); 2,493 (12,1); 2,121 (16,0); 1,398 (0,9); 1,163 (3,3); 1,145 (6,7); 1,128 (3,2); 0,008 (1,3); 0,000 (35,4); -0,008 (1,4)

Приклад I-04: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,744 (1,2); 7,627 (0,5); 7,574 (2,2); 7,570 (2,4); 7,554 (2,5); 7,550 (2,6); 7,320 (1,1); 7,316 (1,1); 7,299 (1,9); 7,297 (2,0); 7,281 (1,5); 7,277 (1,5); 7,146 (1,4); 7,142 (1,6); 7,126 (2,1); 7,123 (2,3); 7,107 (1,1); 7,104 (1,2); 6,996 (6,1); 6,968 (1,4); 6,944 (0,7); 6,814 (2,0); 6,811 (2,2); 6,793 (1,9); 6,790 (2,0); 5,753 (0,9); 3,449 (0,5); 3,433 (0,6); 3,379 (0,5); 3,363 (1,1); 3,345 (1,0); 3,315 (11,3); 3,002 (1,6); 2,935 (3,8); 2,524 (0,6); 2,520 (0,8); 2,511 (12,0); 2,506 (24,7); 2,502 (33,4); 2,497 (25,1); 2,493 (12,6); 2,082 (16,0); 1,989 (0,5); 1,398 (0,6); 1,176 (0,5); 1,165 (3,6); 1,147 (7,6); 1,130 (3,6); 0,008 (1,0); 0,000 (28,7); -0,009 (1,1)

Приклад I-05: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,757 (1,4); 7,644 (0,6); 7,573 (2,3); 7,569 (2,4); 7,553 (2,5); 7,549 (2,6); 7,316 (1,1); 7,312 (1,1); 7,295 (2,1); 7,294 (2,1); 7,277 (1,5); 7,273 (1,4); 7,143 (1,4); 7,140 (1,6); 7,124 (2,2); 7,121 (2,3); 7,105 (1,2); 7,101 (1,2); 6,969 (1,8); 6,945 (0,8); 6,861 (6,6); 6,811 (2,3); 6,808 (2,4); 6,791 (2,1); 6,788 (2,2); 3,453 (0,6); 3,437 (0,6); 3,379 (0,6); 3,362 (1,3); 3,345 (1,3); 3,325 (7,9); 3,002 (1,7); 2,933 (4,3); 2,509 (9,6); 2,504 (12,4); 2,500 (9,2); 2,093 (16,0); 2,071 (0,9); 1,397 (11,6); 1,324 (0,5); 1,162 (2,1); 1,146 (4,2); 1,129 (2,5); 0,000 (3,1)

Приклад I-06: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,898 (1,9); 7,881 (1,9); 7,879 (1,9); 7,753 (1,2); 7,641 (0,5); 7,359 (0,9); 7,340 (1,8); 7,323 (1,0); 7,320 (1,0); 7,030 (0,3); 6,965 (1,8); 6,919 (1,2); 6,901 (2,3); 6,881 (1,0); 6,822 (5,0); 6,743 (0,6); 6,701 (2,0); 6,681 (1,9); 3,448 (0,5); 3,436 (0,6); 3,361 (1,1); 3,344 (1,2); 3,319 (11,6); 3,000 (1,5); 2,930 (3,7); 2,502 (31,0); 2,162 (0,4); 2,085 (12,9); 2,062 (1,2); 1,398 (16,0); 1,337 (0,3); 1,320 (0,6); 1,160 (1,8); 1,144 (3,7); 1,129 (2,3); 0,000 (24,3)

Приклад I-07: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,744 (1,5); 7,716 (2,4); 7,696 (2,5); 7,628 (0,7); 7,354 (1,1); 7,336 (2,3); 7,315 (1,3); 7,074 (1,4); 7,056 (2,4); 7,037 (1,2); 6,992 (5,6); 6,969 (1,8); 6,944 (0,9); 6,783 (2,4); 6,762 (2,2); 3,448 (0,7); 3,434 (0,8); 3,363 (1,4); 3,345 (1,4); 3,320 (9,0); 3,002 (2,2); 2,935 (4,7); 2,502 (26,3); 2,078 (16,0); 1,165 (3,8); 1,147 (7,6); 1,130 (3,8); 0,000 (0,9)

Приклад VI-01: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,181 (4,3); 7,504 (0,9); 7,501 (0,6); 7,484 (1,4); 7,479 (1,0); 7,477 (1,1); 7,473 (0,7); 7,455 (1,1); 7,391 (0,4); 7,386 (0,6); 7,380 (0,5); 7,374 (1,3); 7,369 (1,6); 7,363 (0,9); 7,356 (2,0); 7,351 (2,7); 7,337 (2,4); 7,329 (2,9); 7,325 (2,5); 7,312 (1,4); 7,309 (1,2); 7,304 (0,4); 7,291 (0,4); 7,288 (0,4); 6,861 (4,8); 3,330 (25,8); 2,513 (11,4); 2,509 (22,7); 2,504 (29,8); 2,499 (22,0); 2,495 (11,0); 2,364 (16,0); 0,008 (0,5); 0,000 (14,3); -0,008 (0,5)

Приклад VI-03: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,138 (4,6); 7,500 (0,8); 7,496 (0,6); 7,479 (1,3); 7,470 (1,0); 7,450 (1,1); 7,386 (0,4); 7,380 (0,5); 7,374 (0,5); 7,366 (1,4); 7,364 (1,4); 7,359 (1,5); 7,351 (1,1); 7,345 (2,6); 7,332 (1,4); 7,326 (3,8); 7,321 (2,9); 7,309 (1,4); 7,300 (0,4); 7,289 (0,4); 7,285 (0,4); 6,975 (5,0); 3,312 (10,0); 2,526 (0,3); 2,508 (16,3); 2,504 (21,5); 2,499 (16,1); 2,344 (16,0); 0,000 (1,6)

Приклад VI-04: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,314 (4,7); 8,210 (0,5); 8,150 (4,5); 8,148 (4,5); 7,694 (2,0); 7,690 (2,1); 7,674 (2,3); 7,670 (2,3); 7,495 (0,9); 7,491 (0,9); 7,475 (1,9); 7,472 (2,0); 7,456 (1,6); 7,452 (1,5); 7,380 (1,3); 7,377 (1,7); 7,361 (2,0); 7,357 (2,5); 7,337 (3,7); 7,334 (2,3); 7,317 (2,1); 7,313 (1,8); 7,268 (0,4); 7,228 (0,4); 6,871 (6,4); 6,037 (0,8); 3,329 (16,3); 2,526 (0,5); 2,513 (12,0); 2,508 (24,1); 2,504 (31,6); 2,500 (23,5); 2,495 (11,8); 2,351 (2,2); 2,341 (16,0); 0,000 (3,4)

Приклад VI-05: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,187 (4,8); 7,691 (2,2); 7,671 (2,4); 7,496 (0,8); 7,493 (0,9); 7,473 (2,2); 7,457 (1,5); 7,454 (1,6); 7,380 (1,7); 7,361 (2,5); 7,345 (3,3); 7,342 (3,5); 7,325 (1,9); 7,322 (1,9); 6,758 (5,9); 3,323 (6,0); 2,673 (0,5); 2,506 (16,8); 2,364 (16,0)

Приклад VI-06: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,197 (4,9); 8,008 (2,1); 8,005 (2,2); 7,988 (2,2); 7,985 (2,3); 7,541 (1,0); 7,538 (1,0); 7,521 (2,0); 7,519 (2,0); 7,503 (1,3); 7,499 (1,3); 7,263 (2,4); 7,260 (2,6); 7,243 (2,1); 7,240 (2,1); 7,146 (1,3); 7,143 (1,3); 7,127 (2,2); 7,124 (2,2); 7,108 (1,1); 7,105 (1,1); 6,655 (6,2); 3,323 (7,8); 2,509 (11,5); 2,505 (15,1); 2,501 (11,6); 2,375 (16,0); 2,301 (0,4); 2,297 (0,4); 0,008 (0,3); 0,000 (8,1)

Приклад VI-07: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 8,152 (4,7); 7,854 (0,3); 7,833 (2,1); 7,830 (2,1); 7,814 (2,2); 7,810 (2,2); 7,535 (1,0); 7,531 (1,0); 7,513 (2,0); 7,496 (1,4); 7,492 (1,3); 7,323 (2,1); 7,320 (2,8); 7,309 (1,9); 7,304 (2,3); 7,300 (2,3); 7,290 (2,4); 7,271 (1,2); 7,267 (1,0); 6,841 (6,5); 3,323 (10,0); 2,509 (14,0); 2,505 (17,6); 2,500 (12,7); 2,345 (16,0); 2,279 (1,0); 2,275 (1,0); 1,397 (3,1); 0,000 (4,3)

Приклад VIII-01: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,346 (0,9); 7,341 (0,7); 7,339 (0,7); 7,328 (0,9); 7,322 (1,2); 7,317 (1,0); 7,313 (0,9); 7,298 (1,1); 7,293 (1,1); 7,116 (0,4); 7,112 (0,5); 7,097 (1,6); 7,092 (1,5); 7,084 (1,0); 7,079 (2,5); 7,073 (2,3); 7,068 (1,3); 7,065 (1,1); 7,059 (0,9); 7,053 (0,9); 7,049 (1,0); 7,034 (0,4); 6,844 (5,9); 6,778 (1,0); 6,772 (0,9); 6,757 (1,5); 6,754 (1,5); 6,752 (1,5); 6,732 (5,7); 5,205 (5,1); 3,337 (12,7); 2,513 (5,6); 2,509 (11,3); 2,505 (14,8); 2,500 (10,9); 2,077 (0,6); 2,022 (16,0); 0,000 (2,5)

Приклад VIII-03: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,343 (0,9); 7,338 (0,8); 7,325 (1,0); 7,319 (1,3); 7,315 (1,2); 7,310 (1,0); 7,295 (1,2); 7,290 (1,3); 7,185 (0,5); 7,115 (0,6); 7,101 (1,8); 7,096 (1,7); 7,086 (1,5); 7,082 (2,6); 7,076 (2,5); 7,070 (1,7); 7,062 (1,2); 7,056 (1,2); 7,051 (1,2); 7,044 (0,4); 7,037 (0,5); 7,033 (0,5); 7,018 (0,8); 6,959 (5,8); 6,788 (1,0); 6,783 (1,0); 6,763 (1,7); 6,746 (6,1); 6,733 (0,4); 6,381 (0,6); 5,149 (5,1); 4,912 (0,5); 3,313 (10,3); 2,507 (17,2); 2,503 (22,7); 2,499 (17,2); 2,111 (1,9); 2,028 (1,8); 2,016 (16,0); 1,990 (0,4); 0,000 (2,8)

Приклад VIII-04: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,534 (2,1); 7,530 (2,2); 7,525 (0,5); 7,521 (0,5); 7,515 (2,4); 7,511 (2,4); 7,505 (0,5); 7,501 (0,4); 7,488 (0,3); 7,472 (0,3); 7,468 (0,3); 7,267 (1,2); 7,263 (1,1); 7,248 (1,8); 7,246 (1,8); 7,244 (1,9); 7,227 (1,4); 7,223 (1,4); 7,087 (0,4); 7,080 (1,4); 7,076 (1,5); 7,060 (2,1); 7,057 (2,1); 7,041 (1,1); 7,038 (1,1); 7,008 (0,3); 6,978 (6,3); 6,885 (0,3); 6,882 (0,3); 6,771 (0,9); 6,752 (4,8); 6,700 (2,2); 6,696 (2,3); 6,679 (2,2); 6,676 (2,2); 6,652 (0,3); 6,648 (0,4); 6,371 (0,9); 5,754 (0,4); 5,185 (5,0); 4,888 (0,6); 3,321 (13,2); 2,525 (0,4); 2,512 (9,6); 2,508 (19,6); 2,503 (25,8); 2,499 (19,2); 2,494 (9,7); 2,058 (0,7); 1,989 (2,6); 1,970 (16,0); 1,323 (0,4); 0,008 (0,8); 0,000 (23,9); -0,008 (1,0)

Приклад VIII-05: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 9,442 (0,5); 7,533 (2,0); 7,530 (2,0); 7,513 (2,2); 7,510 (2,1); 7,262 (1,0); 7,259 (1,0); 7,242 (2,0); 7,240 (2,0); 7,223 (1,3); 7,219 (1,2); 7,095 (0,4); 7,077 (1,3); 7,073 (1,4); 7,057 (2,1); 7,055 (2,1); 7,038 (1,0); 7,035 (1,0); 6,976 (0,6); 6,945 (0,5); 6,860 (5,8); 6,815 (0,4); 6,796 (0,4); 6,744 (5,1); 6,696 (2,3); 6,693 (2,5); 6,676 (2,2); 6,673 (2,2); 5,224 (5,4); 4,002 (0,4); 3,984 (0,4); 3,328 (4,7); 2,509 (8,6); 2,505 (10,8); 2,501 (8,1); 2,071 (1,4); 1,982 (16,0); 1,396 (0,8); 1,341 (0,4); 1,324 (0,8); 1,307 (0,4); 0,000 (11,4)

Приклад VIII-06: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 7,878 (0,4); 7,863 (2,6); 7,844 (2,6); 7,307 (1,2); 7,288 (2,4); 7,270 (1,6); 7,251 (0,6); 7,232 (1,0); 7,182 (0,5); 7,163 (0,5); 6,901 (0,3); 6,883 (1,1); 6,860 (1,7); 6,840 (3,2); 6,831 (6,2); 6,739 (5,2); 6,582 (2,7); 6,562 (2,6); 5,214 (6,6); 3,322 (8,5); 2,932 (0,6); 2,503 (32,7); 2,301 (1,7); 2,095 (0,9); 2,087 (1,9); 2,072 (2,2); 1,970 (16,0); 1,397 (5,0); 1,144 (0,6); 0,000 (21,3)

Приклад VIII-07: ¹H-ЯМР (400,0 МГц, d₆-ДМСО): δ 9,498 (0,4); 7,679 (2,1); 7,675 (2,2); 7,659 (2,2); 7,656 (2,3); 7,305 (1,0); 7,301 (1,1); 7,284 (1,9); 7,282 (1,9); 7,266 (1,3); 7,262 (1,3); 7,189 (0,4); 7,166 (0,3); 7,108 (0,8); 7,013 (1,3); 7,010 (1,4); 6,993 (2,7); 6,991 (2,6); 6,975 (7,3); 6,936 (0,8); 6,929 (0,6); 6,922 (0,6); 6,813 (0,4); 6,791 (0,6); 6,750 (4,9); 6,671 (2,5); 6,667 (2,6); 6,650 (2,2); 6,647 (2,2); 5,186 (5,6); 5,047 (0,4); 4,006 (0,6); 3,988 (0,6); 3,320 (9,7); 2,507 (24,8); 2,503 (32,3); 2,498 (24,4); 2,086 (1,1); 2,082 (1,1); 2,056 (2,1); 1,964 (16,0); 1,340 (0,6); 1,323 (1,3); 1,306 (0,6); 0,008 (1,7); 0,000 (28,4); -0,008 (1,6)

Приклади даних щодо стабільності

5 Стабільність по відношенню до гідролізу в гомогенному водному розчині - Дослідження стабільності щодо гідролізу

Хімічна стабільність по відношенню до гідролізу феніламінінів, описана в попередньому рівні техніки, є гарною, але покращена стабільність може бути переважною під час отримання та обробок композиціями в великих масштабах. Покращена стабільність по відношенню до гідролізу була доведеною з використанням дослідження щодо стабільності по відношенню до

гідролізу, як описано нижче:

- Для одержання відповідного препарату активної сполуки для дослідження на стабільність по відношенню до гідролізу, готують 1000 м.ч. основного розчину (1 мг/мл) активної речовини в ацетонітрилі. Три аліквоти по 100 мкл відбирають піпеткою у флакони для ВЕРХ та розбавляють 750 мкл ацетонітрилу. В кожен флакон додають 850 мкл відповідного буферного розчину (pH 4, pH 7 та pH 9, CertiPUR, Fa Merck). Буфер, який міститься в флаконах для ВЕРХ, інкубували в нагрітому пробному лотку при 50 °C протягом 24 годин. Кількість А активної речовини аналізують з використанням ВЕРХ (УФ – площа піка при 210 нм) у восьми точках в час t: 0 хв., 140 хв., 350 хв., 560 хв., 770 хв., 980 хв., 1190 хв., 1400 хв. Тривалість періоду напіврозпаду ($T_{1/2}$) кожної активної сполуки розраховується за допомогою лінійної регресії з використанням наступних рівнянь (передбачається, що розпад першого порядку):

$$\ln[A(t)] = -kt + \ln[A(0)]$$

$$T_{1/2} = \frac{\ln 2}{k}$$

- В таблиці III показані результати дослідження на стабільність по відношенню до гідролізу для сполук (I-01), (I-02), (I-03) та (I-04) при різних значеннях pH. Для того, щоб продемонструвати покращену стабільність щодо гідролізу з урахуванням феніламідину, відомого в даній галузі з рівня техніки, результати порівнювали зі сполукою № 1, відомою з WO 2008/110313 та сполукою № 337, відомою з WO 2008/110278. Дані показують, що сполуки відповідно до винаходу дійсно демонструють більш високу стабільність по відношенню до гідролізу. Дана підвищена стабільність буде мати перевагу в процесі отримання та обробки композиціями у великому масштабі в порівнянні з відомими амідинами. Дані слід розглядати лише як приклад та вони не обмежують цілі винаходу.

Таблиця III

Пр. N°	$T_{1/2}$ (pH 7)	$T_{1/2}$ (pH 9)
I-01	52 год.	47 год.
I-02	160 год.	140 год.
I-03	68 год.	51 год.
I-04	64 год.	58 год.
I-05	51 год.	47 год.
I-07	63 год.	57 год.
Сполука № 1, відома з WO 2008/110313	24 год.	16 год.
Сполука № 337, відома з WO 2008/110278	25 год.	17 год.

- Стабільність по відношенню до фотолізу - Дослідження стабільності щодо фотолізу
- Стабільність по відношенню до фотолізу феніламідинів, описана в попередньому рівні техніки, є гарною, але покращена стабільність щодо фотолізу може бути переважною, оскільки це може забезпечити більш тривалу ефективність, коли застосовується до рослин шляхом позакореневого внесення. Покращена стабільність по відношенню до фотолізу була доведеною з використанням дослідження стабільності по відношенню до гідролізу, як описано нижче: Для одержання відповідного препарату активної сполуки для дослідження на стабільність по відношенню до фотолізу готують вихідний розчин 1000 м.ч. (1 мг/мл) активної речовини в ацетонітрилі. Аліквоти по 25 мкл даного вихідного розчину відбирають піпеткою в три лунки мікротитрувального планшета Bio-one (MTP) UVStar 96 (Fa Greiner, арт. № 655801). MTP сушать протягом ночі у темряві, а потім опромінюють при температурі 30 °C та 480 Вт/м² використовуючи пристрій для УФ-опроміненні SUNTEST XLS + або SUNTEST CPS (Fa. Atlas). Кількість А активної речовини аналізується з використанням ВЕРХ (площа УФ-піка при 210 нм) в п'яти точках часу t: 0 год., 2 год., 4 год., 6 год., 24 год., використовуючи наступний спосіб: 200 мкл ацетонітрилу додають у відповідну лунку MTP, та MTP гарметично закривають фольгою Bio-one, зазор 80/140 мм (Fa. Greiner, арт. № 676070). MTP обробляють ультразвуком протягом 3 хвилин та аналізують з використанням ВЕРХ. Тривалість періоду напіврозпаду ($T_{1/2}$) кожної активної сполуки розраховується за допомогою лінійної регресії з використанням наступних рівнянь (передбачається, що розпад першого порядку):

$$\ln[A(t)] = -kt + \ln[A(0)]$$

$$T_{1/2} = \frac{\ln 2}{k}$$

- В таблиці IV показані результати дослідження на стабільність по відношенню до фотолізу для сполук (I-01), (I-02), (I-03) та (I 04). Для того, щоб продемонструвати покращену стабільність щодо фотолізу з урахуванням феніламідину, відомого в даній галузі з рівня техніки, результати порівнювали зі сполукою № 1, відомою з WO 2008/110313. Дані демонструють, що сполуки відповідно до винаходу дійсно демонструють більш високу стабільність по відношенню до фотолізу. Дана підвищена хімічна стабільність по відношенню до фотолізу буде мати перевагу, оскільки буде забезпечувати більш тривалу ефективність, коли їх застосовують до рослин за рахунок позакореневого внесення в порівнянні з відомими амідинами. Дані слід розглядати лише як приклад, та вони не обмежують цілі винаходу.

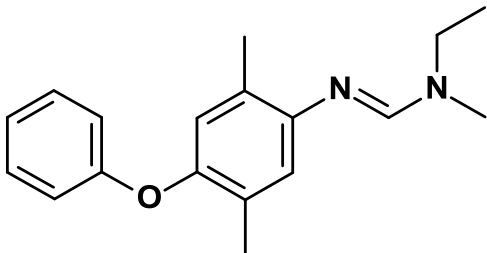
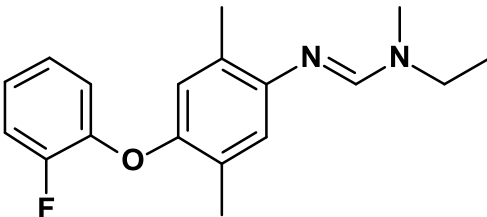
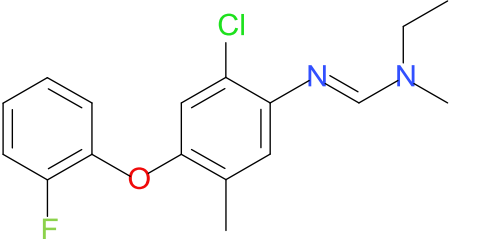
Таблиця IV

Пр. N°	T _{1/2}
I-01	> 200 год.
I-02	185 год.
I-03	178 год.
I-04	> 200 год.
Сполука № 1, відома з WO 2008/110313	10 год.

- Дослідження щодо сумісності з рослиною з використанням соєвих рослин
 Розчинник: 24,5 частин за масою ацетону
 24,5 частин за масою диметилацетаміду
 Емульгатор: 1 частина за масою алкіларилполігліколевого простого ефіра
 Для того, щоб отримати прийнятний препарат активної сполуки, 1 частину за масою активної сполуки змішують із встановленими кількостями розчинника та емульгатора, та концентрат розбавляють водою до бажаної концентрації. Молоді рослини обприскують препаратом активної сполуки зі встановленою нормою застосування. Рослини потім розміщують в теплиці при приблизно 21 °C та відносній атмосферній вологості приблизно 80 %. Дослідження оцінюють через 6 днів після застосування та включає пошкодження рослин, таке як деформація листя, хлороз, некроз, ушкодження вогнем або затримка росту. Результати підсумовуються в таблиці V. 0 % означає, що ніяких ушкоджень не спостерігається, при цьому 100 % означає, що рослини є повністю ушкодженими.

Таблиця V

Соя рослинна сумісність

	Активна сполука Відома з WO 2008/110313:	Норма застосування активної сполуки в м.ч.	Некро в %
Пр. 1		1000	90
	Відома з WO 2008/110278:		
Пр. 337		1000	90
	Відповідно до винаходу:		
Пр. I-01		1000	20

Приклади застосування

Приклад: превентивне дослідження in vivo щодо *Russinia recondita* (коричневої іржі на пшениці)

Розчинник: 5 % за об'ємом диметилсульфоксида

10 % за об'ємом ацетона

Емульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного інгредієнта

Активні інгредієнти розчиняють та гомогенізують в суміші диметилсульфоксид/ацетон/Tween® 80 та потім розбавляють у воді до бажаної концентрації.

Молоді рослини пшениці обробляють шляхом обприскування активним інгредієнтом, отриманим як описано вище. Контрольні рослини обробляють тільки водним розчином ацетон/диметилсульфоксид/Tween® 80.

Через 24 години рослини інфікують шляхом розпилення на листя водної суспензії спор *Russinia recondita*. Інфіковані рослини пшениці інкубують протягом 24 годин при 20 °C та при 100 % відносній вологості та потім протягом 10 днів при 20 °C та при 70-80 % відносній вологості.

Дослідження оцінюють через 11 днів після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає ефективності контрольних рослин, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 500 м.ч. активного інгредієнта: I-01; I-02; I-03; I-04.

Приклад: превентивне дослідження in vivo щодо *Pyrenophora teres* (сіткоподібна плямистість на ячмінні)

Розчинник: 5 % за об'ємом диметилсульфоксида

10 % за об'ємом ацетону

Емульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного інгредієнта

Активні інгредієнти розчиняють та гомогенізують в суміші диметилсульфоксид/ацетон/ Tween® 80 та потім розбавляють у воді до бажаної концентрації.

5 Молоді рослини ячміню обробляють шляхом обприскування активним інгредієнтом, отриманим, як описано вище. Контрольні рослини обробляють тільки водним розчином ацетон/диметилсульфоксид/ Tween® 80.

Через 24 години, рослини інфікують шляхом розпилення на листя водної суспензії спор *Puccinia teres*. Інфіковані рослини ячменю інкубують протягом 48 годин при 20 °C та при 100 % відносній вологості та потім протягом 12 днів при 20 °C та при 70-80 % відносній вологості.

Дослідження оцінюють через 14 днів після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає ефективності контрольних рослин, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

15 В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 500 м.ч. активного інгредієнта: I-01; I-03; I-04

Приклад: превентивне дослідження *in vivo* щодо *Septoria tritici* (плямистість листя на пшениці)

Розчинник: 5 % за об'ємом диметилсульфоксиду 10 % за об'ємом ацетону

20 Емульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного інгредієнта

Активні інгредієнти розчиняють та гомогенізують в суміші диметилсульфоксид/ацетон/ Tween® 80 та потім розбавляють у воді до бажаної концентрації.

Молоді рослини пшениці обробляють шляхом обприскування активним інгредієнтом отриманим, як описано вище. Контрольні рослини обробляють тільки водним розчином ацетон/диметилсульфоксид/ Tween® 80.

Через 24 години, рослини інфікують шляхом розпилення на листя водної суспензії спор *Septoria tritici*. Інфіковані рослини пшениці інкубують протягом 72 годин при 18 °C та при 100 % відносній вологості та потім протягом 21 днів при 20 °C та при 90 % відносній вологості.

30 Дослідження оцінюють через 24 дні після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає ефективності контрольних рослин, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 500 м.ч. активного інгредієнта: I-01; I-02; I-04

35 Приклад: превентивне дослідження *in vivo* щодо *Sphaerotheca fuliginea* (справжня борошниста роса на гарбузах)

Розчинник: 5 % за об'ємом диметилсульфоксиду 10 % за об'ємом ацетону

Емульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного інгредієнта

Активні інгредієнти розчиняють та гомогенізують в суміші диметилсульфоксид/ацетон/ Tween® 80 та потім розбавляють у воді до бажаної концентрації.

40 Молоді рослини гарбуза обробляють шляхом обприскування активним інгредієнтом отриманим, як описано вище. Контрольні рослини обробляють тільки водним розчином ацетон/диметилсульфоксид/ Tween® 80.

Через 24 години, рослини інфікують шляхом розпилення на листя водної суспензії спор *Sphaerotheca fuliginea*. Інфіковані рослини гарбуза інкубують протягом 72 годин при 18 °C та при 100 % відносній вологості та потім протягом 12 днів при 20 °C та при 70-80 % відносній вологості.

Дослідження оцінюють через 15 днів після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає ефективності контрольних рослин, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

50 В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 500 м.ч. активного інгредієнта: I-01; I-02; I-03; I-04.

Приклад: превентивне дослідження *in vivo* щодо *Uromyces appendiculatus* (бобова іржа)

Розчинник: 5 % за об'ємом диметилсульфоксиду 10 % за об'ємом ацетону

Емульгатор: 1 мкл Tween® 80 на мг активного інгредієнта

55 Активні інгредієнти розчиняють та гомогенізують в суміші диметилсульфоксид/ацетон/ Tween® 80 та потім розбавляють у воді до бажаної концентрації.

Молоді рослини бобів обробляють шляхом обприскування активним інгредієнтом, отриманим як описано вище. Контрольні рослини обробляють тільки водним розчином ацетон/диметилсульфоксид/ Tween® 80.

60 Через 24 години рослини інфікують шляхом розпилення на листя водної суспензії спор

Uromyces appendiculatus. Інфіковані рослини бобів інкубували протягом 24 годин при 20 °C та при 100 % відносній вологості та потім протягом 10 днів при 20 °C та при 70-80 % відносній вологості.

Дослідження оцінюють через 11 днів після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає ефективності контрольних рослин, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 500 м.ч. активного інгредієнта: I-01; I-02; I-03; I-04.

Приклад: превентивне дослідження *in vivo* щодо *Phakopsora* (соєа)

Розчинник: 24,5 частин за масою ацетона 24,5 частин за масою диметилацетаміду

Емульгатор: 1 частина за масою алкіларилполігліколевого простого ефіру

Для того, щоб отримати прийнятний препарат активної сполуки, 1 частину за масою активної сполуки змішують із зазначеними кількостями розчинника та емульгатора, та концентрат розбавляють водою до бажаної концентрації.

Для дослідження превентивної активності, молоді рослини обприскують препаратом активної сполуки із зазначеними нормами застосування. Після того, як розпилене покриття висихає, рослини інокують водною суспензією спор збудника захворювання соєвої іржі (*Phakopsora pachyrhizi*) та залишають протягом 24 годин без світла в інкубаційній шафі при приблизно 24 °C та відносній вологості повітря 95 %.

Рослини залишаються в інкубаційній шафі при приблизно 24 °C та відносній вологості повітря приблизно 80 % та на 12 годинний період день/ніч.

Дослідження оцінюють через 7 днів після інокуляції. 0 % означає ефективність, яка відповідає рівню необробленого контролю, тоді як ефективність 100 % означає, що не спостерігається жодне захворювання.

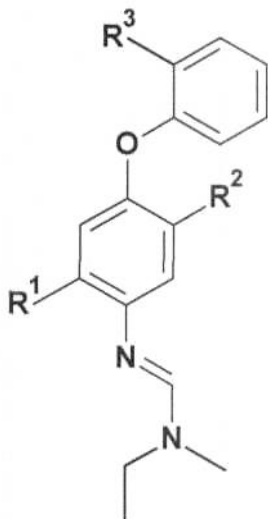
В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 10 м.ч. активного інгредієнта: I-02; I-03; I-04.

В даному дослідженні, наступні сполуки відповідно до винаходу показали ефективність щонайменше 70 % при концентрації 100 м.ч. активного інгредієнта: I-01.

30

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Феноксифеніламідин загальної формули (I):



, (I):

в якій

35 R¹ вибирають з групи, яка складається з галогену та галогенметилу;

R² являє собою метил;

R³ являє собою галоген.

2. Феноксифеніламідин за пунктом 1, в якій:

40 R¹ вибирають з групи, яка складається з фтору, хлору, бром, дихлорметилу, трихлорметилу, фторметилу, дифторметилу та трифторметилу;

R² являє собою метил;

R³ вибирають з групи, яка складається з бром, хлору та фтору.

3. Феноксифеніламідин за пунктом 1 або 2, в якій:

R^1 вибирають з групи, яка складається з хлору, бром, дифторметилу та трифторметилу;

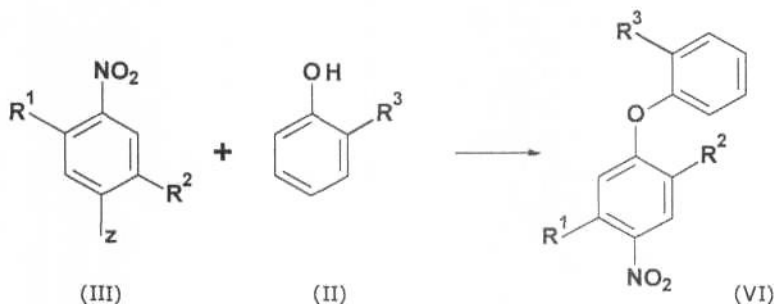
R^2 являє собою метил;

R^3 вибирають з групи, яка складається з фтору та хлору.

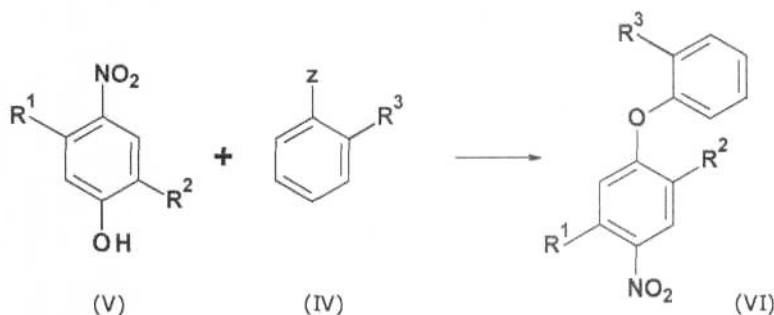
- 5 4. Феноксифеніламідин за будь-яким з пунктів 1-3, який вибирають з групи, яка складається з N'-[2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-(дифторметил)-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-бром-4-(2-фторфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-бром-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-хлор-4-(2-хлорфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-хлор-4-(2-йодфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду, N'-[2-бром-4-(2-бромфенокси)-5-метилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформаміду.

5. Спосіб отримання феноксифеніламідину за будь-яким з пунктів 1-4, який включає щонайменше одну з наступних стадій (а)-(j):

- 15 (а) взаємодію похідних нітробензолу формули (III) з похідними фенолу формули (II) відповідно до схеми реакції нижче:

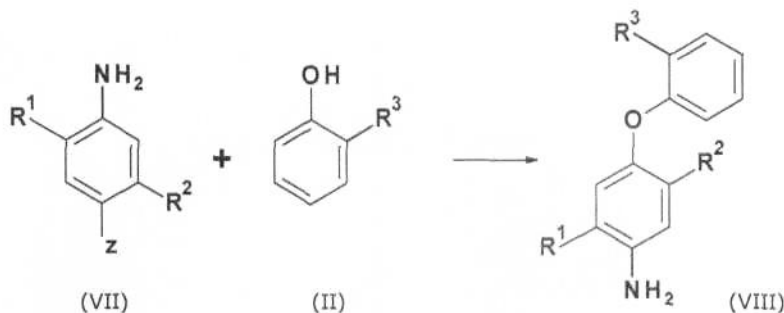


(b) взаємодію похідних нітрофенолу формули (V) з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:

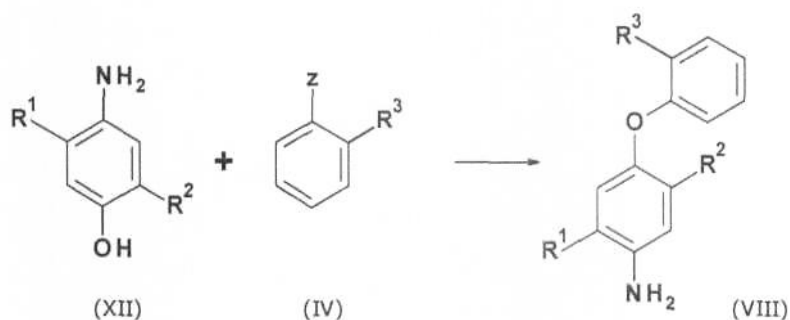


20

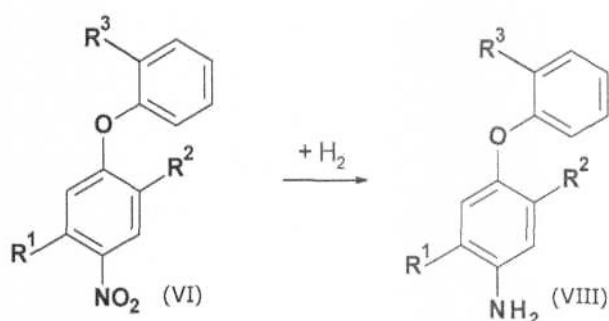
(c) взаємодію анілінів формули (VII) з фенолами (II) відповідно до схеми реакції нижче:



(d) взаємодію амінофенолів формули (XII) з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:

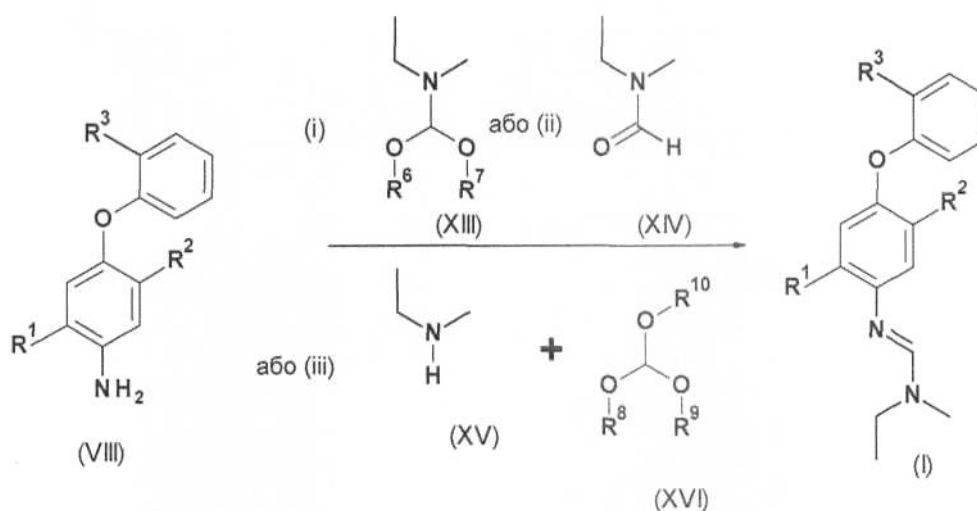


(е) відновлення нітрофенокси простих ефірів формули (VI) до амінофенілових простих ефірів формули (VIII) відповідно до схеми реакції нижче:

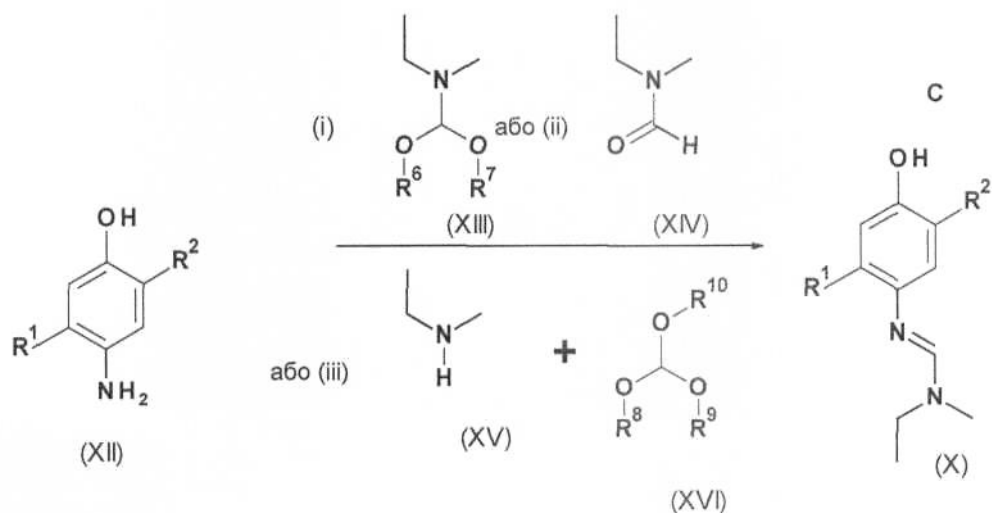


5

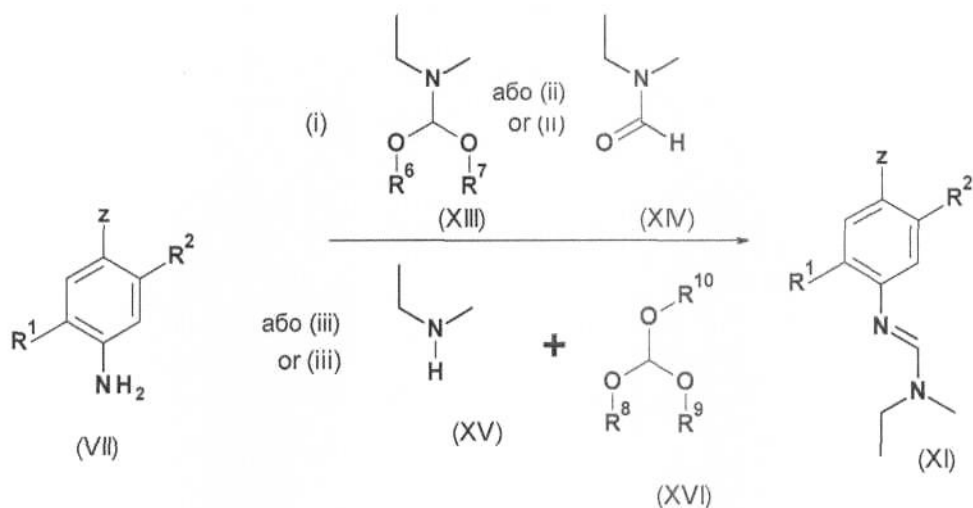
(f) взаємодію амінофенілових простих ефірів формули (VIII) з
 (i) аміноацетелями формули (XIII) або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV), або
 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI)
 10 відповідно до схеми реакції нижче:



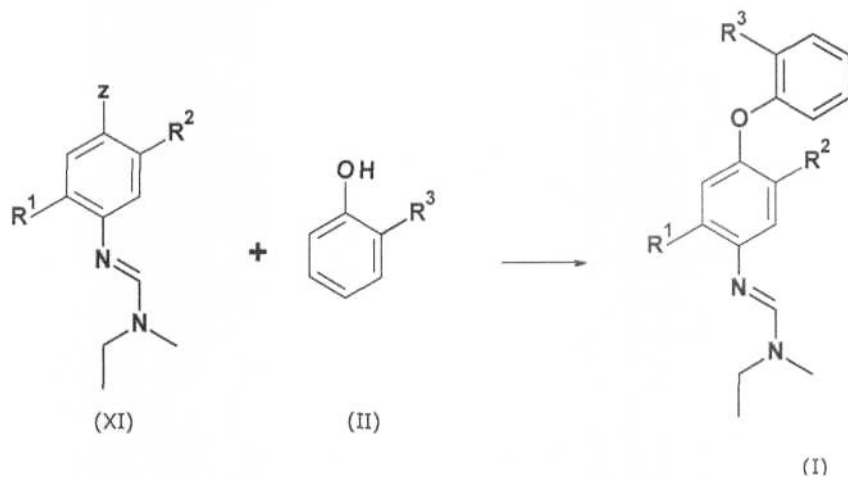
(g) взаємодію амінофенолів формули (XII) з
 (i) аміноацетелями формули (XIII), або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV) або
 15 (iv) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI)
 відповідно до схеми реакції нижче:



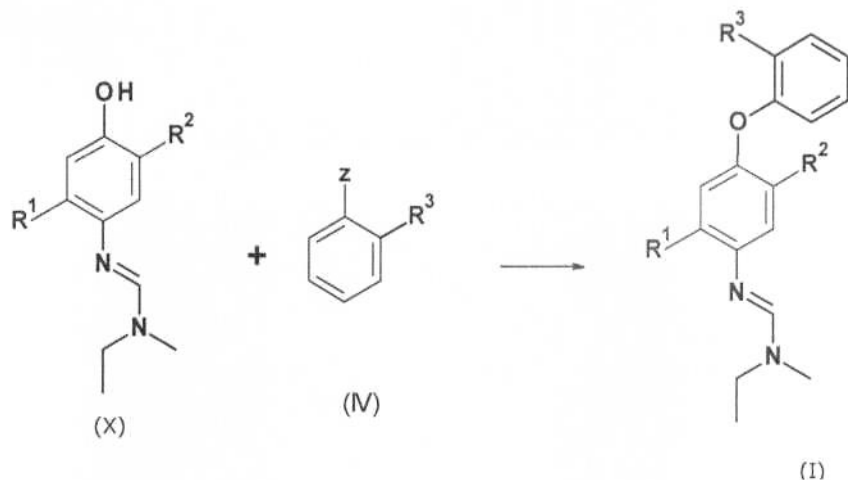
- (h) взаємодію анілінів формули (VII) з
 (i) аміноацеталями формули (XIII) або
 (ii) з N-етил-N-метилформамідом формули (XIV), або
 5 (iii) з N-метилетанаміном формули (XV) в присутності складних ортоєфірів формули (XVI) відповідно до схеми реакції нижче:



- (i) взаємодію амідинів формули (XI) з похідними фенолу формули (II) відповідно до схеми реакції нижче:



(j) взаємодію амідинів формули (X) з похідними фенолу формули (IV) відповідно до схеми реакції нижче:



де в зазначених вище схемах:

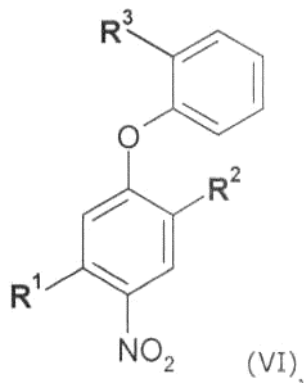
5 Z являє собою групу, яка відщеплюється;

від R¹ до R³ мають значення, як в пункті 1;

R⁶ та R⁷ незалежно один від одного вибирають з групи, яка складається з C₁₋₁₂-алкільної, C₂₋₁₂-алкенільної, C₂₋₁₂-алкінійної або C₅₋₁₈-арильної або C₇₋₁₉-арилалкільної групи, та разом з атомами, до яких вони є приєднаними, можуть утворювати п'яти-, шести- або семичленне кільце;

10 від R⁸ до R¹⁰ незалежно один від одного вибирають з групи, яка складається з C₁₋₁₂-алкільної, C₂₋₁₂-алкенільної, C₂₋₁₂-алкінійної або C₅₋₁₈-арильної або C₇₋₁₉-арилалкільної, C₇₋₁₉-алкіларильної групи, та в кожному випадку R⁸ з R⁹, R⁹ з R¹⁰ або R⁸ з R¹⁰ разом з атомами, до яких вони є приєднаними, та, у випадку необхідності, разом з додатковими атомами вуглецю, азоту, кисню або сірки можуть утворювати п'яти-, шести- або семичленне кільце.

15 6. Нітрофеніловий простий ефір формули (VI):



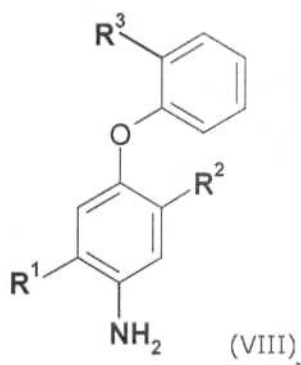
в якому:

R¹ вибирають з групи, яка складається з хлору, бром, дифторметилу та трифторметилу;

20 R² являє собою метил;

R³ вибирають з групи, яка складається з фтору та хлору.

7. Амінофеніловий простий ефір формули (VIII):



в якому:

R¹ вибирають з групи, яка складається з фтору, бром, дихлорметилу, трихлорметилу, фторметилу, дифторметилу та трифторметилу;

5 R² являє собою метил;

R³ вибирають з групи, яка складається з бром, хлору та фтору.

8. Агрохімічна композиція для контролю за небажаними мікроорганізмами, яка містить щонайменше один феноксифеніламідин за будь-яким з пунктів 1-4.

10 9. Застосування феноксифеніламідину за будь-яким з пунктів 1-4 або агрохімічної композиції за пунктом 8 для контролю за небажаними мікроорганізмами.

10. Спосіб контролю за небажаними мікроорганізмами, який характеризується тим, що заміщений феноксифеніламідин за будь-яким з пунктів 1-4 або агрохімічну композицію за пунктом 8 застосовують до мікроорганізмів та/або їх середовища існування.

11. Насіння, що містить щонайменше один феноксифеніламідин за будь-яким з пунктів 1-4.

15 12. Застосування феноксифеніламідину за будь-яким з пунктів 1-4 для обробки насіння.

13. Застосування феноксифеніламідину за будь-яким з пунктів 1-4 для обробки трансгенних рослин.

14. Застосування феноксифеніламідину за будь-яким з пунктів 1-4 для обробки насіння трансгенних рослин.

20 15. Спосіб захисту насіння від небажаних мікроорганізмів шляхом застосування насіння, обробленого щонайменше одним феноксифеніламідином за будь-яким з пунктів 1-4.