

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202192756 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2021.12.03(22) Дата подачи заявки
2020.04.20(51) Int. Cl. A01N 47/18 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)

(54) СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫЙ ИЛИ САДОВОДЧЕСКИЙ ФУНГИЦИД, СПОСОБ БОРЬБЫ С БОЛЕЗНЯМИ РАСТЕНИЙ И ПРОДУКТ ДЛЯ БОРЬБЫ С БОЛЕЗНЯМИ РАСТЕНИЙ

(31) 2019-080497

(32) 2019.04.19

(33) JP

(86) PCT/JP2020/016993

(87) WO 2020/213739 2020.10.22

(71) Заявитель:

КУРЕХА КОРПОРЕЙШН (JP)

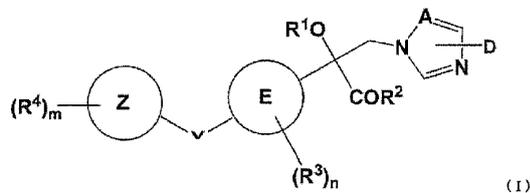
(72) Изобретатель:

Татэиси Хидэаки, Кимура Эрина,
Косияма Тацуюки, Исикава Маюми
(JP)

(74) Представитель:

Носырева Е.Л. (RU)

(57) Предложен сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид, который обладает низкой токсичностью для людей и животных, отличается превосходной безопасностью при обращении и обладает превосходным эффектом борьбы с широким спектром болезней растений и высоким противомикробным действием в отношении грибковых болезней растений. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему изобретению включает производное азолы, представленное следующей общей формулой (I), в качестве активного ингредиента, и дополнительно включает другой активный ингредиент.



A1

202192756

202192756

A1

СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫЙ ИЛИ САДОВОДЧЕСКИЙ ФУНГИЦИД, СПОСОБ БОРЬБЫ С БОЛЕЗНЯМИ РАСТЕНИЙ И ПРОДУКТ ДЛЯ БОРЬБЫ С БОЛЕЗНЯМИ РАСТЕНИЙ

5 ОБЛАСТЬ ТЕХНИЧЕСКОГО ПРИМЕНЕНИЯ

[0001] Настоящее изобретение относится к сельскохозяйственному или садоводческому фунгициду, способу борьбы с болезнями растений и продукту для борьбы с болезнями растений. В частности, настоящее изобретение относится к сельскохозяйственному или садоводческому фунгициду, включающему в себя множество активных компонентов, способу борьбы с болезнями растений с использованием фунгицида и продукту для борьбы с болезнями растений, включающему в себя множество активных компонентов по отдельности.

ПРЕДПОСЫЛКИ СОЗДАНИЯ ИЗОБРЕТЕНИЯ

[0002] Существует потребность в сельскохозяйственных или садоводческих фунгицидах, которые обладают низкой токсичностью для людей и животных, превосходной безопасностью при обращении и высокой эффективностью в борьбе с широким спектром заболеваний растений. Фунгициды на основе азола известны как сельскохозяйственные или садоводческие фунгициды, имеющие высокую эффективность в борьбе с заболеваниями.

СПИСОК БИБЛИОГРАФИЧЕСКИХ ССЫЛОК

Патентный документ

25

[0003] Патентный документ 1: JP 2014-520832 T
Патентный документ 2: JP 58-170770 A

ИЗЛОЖЕНИЕ СУЩНОСТИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

30

Техническая проблема

[0004] В области борьбы с болезнями с использованием сельскохозяйственных или садоводческих фунгицидов существуют такие проблемы, как воздействие на нецелевые организмы и окружающую среду, а также появление устойчивых к химическим средствам грибков. Таким образом, для снижения токсичности для нецелевых организмов и повреждений окружающей среды, а также для подавления развития химической устойчивости существует

потребность в химических веществах, которые могут обеспечивать высокий эффект контроля при одновременном снижении диспергирующего количества химических веществ.

5 [0005] Настоящее изобретение было разработано с учетом вышеуказанных проблем, и целью настоящего изобретения является обеспечение сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, удовлетворяющего вышеуказанные требования.

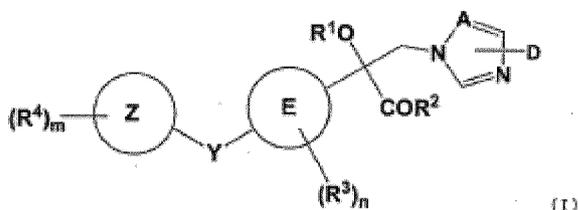
[Решение проблемы]

10 [0006] Для решения вышеуказанных проблем авторы настоящего изобретения интенсивно изучали и обнаружили, что производное азола, представленное следующей общей формулой (I), обладает превосходной активностью и что смешанная композиция производного азола и другого активного ингредиента обеспечивает синергетический эффект и, таким образом, завершили настоящее изобретение.

15 [0007] Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему изобретению включает производное азола, представленное следующей общей формулой (I), в качестве активного компонента, и дополнительно включает другой активный компонент:

[0008] [Хим. 1]

20



где

25 A представляет собой N или CH;

D представляет собой водород, галогеновую группу или SR^D ;

30 причем R^D представляет собой водород, цианогруппу, C_1 - C_6 -алкильную группу, C_1 - C_6 -галогеналкильную группу, C_2 - C_6 -алкенильную группу, C_2 - C_6 -галогеналкенильную группу, C_2 - C_6 -алкинильную группу или C_2 - C_6 -галогеналкинильную группу;

R^1 представляет собой водород, C_1 - C_6 -алкильную группу, C_2 - C_6 -алкенильную группу, C_2 - C_6 -алкинильную группу, C_3 - C_8 -циклоалкильную группу, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_4 -алкильную

группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу, фенил-С₂-С₄-алкинильную группу или COXR⁵.

5 причём R⁵ представляет собой водород, С₁-С₆-алкильную группу, С₂-С₆-алкенильную группу, С₂-С₆-алкинильную группу, С₃-С₈-циклоалкильную группу, С₃-С₈-циклоалкил-С₁-С₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу;

Х представляет собой одинарную связь, -О- или -NR⁶-;

10

R⁶ представляет собой водород, С₁-С₆-алкильную группу, С₂-С₆-алкенильную группу, С₂-С₆-алкинильную группу, С₃-С₈-циклоалкильную группу, С₃-С₈-циклоалкил-С₁-С₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу; а R⁵ и R⁶ могут образовывать кольцо;

15

R² представляет собой -OR⁷ или -NR⁸R⁹;

каждый из R⁷, R⁸ и R⁹ независимо представляет собой водород, С₁-С₆-алкильную группу, С₂-С₆-алкенильную группу, С₂-С₆-алкинильную группу, С₃-С₈-циклоалкильную группу, С₃-С₈-циклоалкил-С₁-С₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу, при этом R⁸ и R⁹ могут образовывать кольцо,

20

Алифатические группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ может иметь 1, 2, 3 или возможное максимальное число одинаковых или разных групп R^a, при этом R^a независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, С₁-С₄-алкоксигруппы и С₁-С₄-галогеналкоксигруппы.

25

R⁴ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, аминогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, С₁-С₄-алкильную группу, С₁-С₄-галогеналкильную группу, С₁-С₄-алкоксигруппу или С₁-С₄-галогеналкоксигруппу, С₁-С₄-алкиламиногруппу, С₁-С₄-диалкиламиногруппу, С₁-С₄-алкилациламиногруппу, -SOR¹⁰ или -SF₅;

30

циклоалкиламиногруппа или фенильный фрагмент в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ или фенильный фрагмент в R⁴ могут иметь 1, 2, 3, 4, 5 или возможное максимальное количество одинаковых или разных групп R^b, при этом R^b независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, С₁-С₄-алкильной группы, С₁-С₄-алкоксигруппы, С₁-С₄-галогеналкильной группы

35

и C₁-C₄-галогеналкоксигруппы;

R³ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, C₁-C₄-алкильную группу, C₁-C₄-галогеналкильную группу, C₁-C₄-алкоксигруппу, C₁-C₄-галогеналкоксигруппу, -SOR¹⁰ или -SF₅;

причем R¹⁰ представляет собой C₁-C₄-алкильную группу или C₁-C₄-галогеналкильную группу;

E представляет собой фенильную группу или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N;

n R³ связаны с любыми положениями замещения;

если E представляет собой фенильную группу, то n равно 0, 1, 2, 3 или 4, и если E представляет собой 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N, то n представляет собой 0, 1 или 2;

Y представляет собой атом кислорода, -CH₂O-, -OCH₂-, -NH-, -N(C₁-C₄-алкил)-, -N(C₃-C₆-циклоалкил)- или -S(O)_p-, который связан с любыми положениями на E;

p равно 0, 1 или 2;

Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, которая представляет собой фенильную или нафтильную группу, 5- или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, или 9- или 10-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, состоящее из двух колец;

m R⁴ связаны с любыми положениями замещения;

если Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, то m равно 1, 2, 3, 4 или 5, а если Z представляет собой ароматическое гетероциклическое кольцо, то m равно 0, 1, 2, 3 или 4.

ПРЕИМУЩЕСТВА ИЗОБРЕТЕНИЯ

35

[0009] Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему изобретению обладает превосходной фунгицидной активностью против многих грибов, которые вызывают

заболевания растений и могут уменьшать количество применяемого каждого активного ингредиента.

ОПИСАНИЕ ВАРИАНТОВ ОСУЩЕСТВЛЕНИЯ

5

[0010] Ниже будет описан предпочтительный вариант осуществления настоящего изобретения.

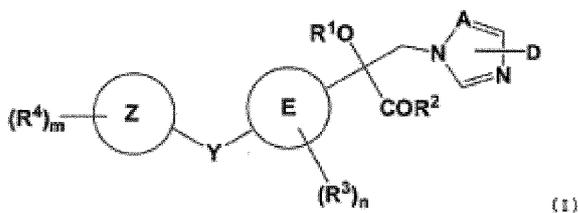
[0011] Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид в соответствии с настоящим вариантом осуществления включает множество активных компонентов и, в частности, включает конкретное производное азота в качестве активного компонента и дополнительно включает другой активный компонент. Включение множества активных ингредиентов обеспечивает эффект, который превосходит эффект, предсказываемый в соответствии с результатами, полученными при использовании каждого активного ингредиента по 10
15

[0012] [1. Производное азота]

Производное азота, которое представляет собой один из множества активных компонентов, содержащихся в сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему варианту осуществления, представлено следующей общей формулой (I) (в дальнейшем называемой производным азота (I)).

[0013] [Хим. 2]

25



В общей формуле (I) А представляет собой N или CH, предпочтительно N. D представляет собой водород, галогеновую группу или SR^D, а R^D представляет собой водород, цианогруппу, 30
C₁-C₆-алкильную группу, C₁-C₆-галогеналкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-галогеналкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу или C₂-C₆-галогеналкинильную группу. D предпочтительно представляет собой водород.

[0014] C₁-C₆-алкильная группа представляет собой линейную или разветвленную алкильную группу, содержащую от 1 до 6 атомов углерода, такую как метил, этил, н-пропил, изопропил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1-этилпропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, 2-метилбутил, 3,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 1,1-диметилбутил, пентил, 1-метилпентил, неопентил и 1,1-диметилэтил.

[0015] C₂-C₆-алкенильная группа представляет собой линейную или разветвленную алкенильную группу, имеющую от 2 до 6 атомов углерода, например, этенильную, 2-пропенильную, 1-метил-2-пропенильную, 2-метил-2-пропенильную, 1-бутенильную, 2-бутенильную, 3-метил-2-бутенильную, 1-метил-2-бутенильную, 3-бутенильную, 1-пентенильную, 2-пентенильную, 1-гексенильную и 5-гексенильную группы.

[0016] C₂-C₆-алкинильная группа представляет собой линейную или разветвленную алкинильную группу с 2–6 атомами углерода, такую как этинильная, 1-пропинильная, 2-пропинильная, 1-бутинильная, 2-бутинильная, 3-бутинильная, пентинильная и 1-гексинильная группы.

[0017] C₁-C₆-галогеналкильная группа, C₂-C₆-галогеналкенильная группа или C₂-C₆-галогеналкинильная группа представляет собой вышеупомянутую C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу или C₂-C₆-алкинильную группу, замещенную одним или более атомами галогена в замещаемом положении, и при наличии двух или более заместителей галогена заместители могут быть одинаковыми или отличаться между собой. Примеры галогеновой группы включают в себя хлорную, бромную, йодную и фторную группы. Конкретные примеры включают в себя хлорметильную, 2-хлорэтильную, 2,3-дихлорпропильную, бромметильную, хлордифторметильную, трифторметильную и 3,3,3-трифторпропильную группы.

[0018] R¹ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу, фенил-C₂-C₄-алкинильную группу или COXR⁵. Примеры C₁-C₆-алкильной группы, C₂-C₆-алкенильной группы и C₂-C₆-алкинильной группы в R¹ могут включать группы, показанные в качестве примеров органических групп, представленных R^D. R¹ предпочтительно представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу или COXR⁵, и более предпочтительно водород, C₁-C₆-алкильную группу или COXR⁵, и наиболее предпочтительно водород или C₁-C₆-алкильную группу.

[0019] C₃-C₈-циклоалкильная группа представляет собой циклический алкил с 3-8 атомами углерода, например, циклопропильную, циклобутильную, циклопентильную, циклогексильную, циклогептильную и циклооктильную группы.

5 [0020] C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильная группа представляет собой циклическую циклоалкильную группу, содержащую от 3 до 8 атомов углерода, связанную с линейной или разветвленной алкильной группой, содержащей от 1 до 4 атомов углерода. Их конкретные
10 примеры включают в себя циклопропилметильную, циклобутилметильную, циклопентилметильную, циклогексилметильную, 2-циклопропилэтильную, 1-циклопропилэтильную, 2-циклогексилэтильную, 3-циклопропилпропильную, 2-циклопропилпропильную и 4-циклопропилбутильную группы.

[0021] Фенил-C₁-C₄-алкильная группа представляет собой линейную или разветвленную алкильную группу, имеющую от 1 до 4 атомов углерода, замещенную фенильной группой, и ее
15 примеры включают, например, фенилметильную, 2-фенилэтильную, 3-фенилпропильную и 4-фенилбутильную группы.

[0022] Фенил-C₂-C₄-алкенильная группа включает линейную или разветвленную алкенильную группу, имеющую от 2 до 4 атомов углерода, связанную с фенильной группой, и
20 ее примеры включают, например, фенилэтенильную, фенил-1-пропенильную, фенилизопропенильную и фенилбутенильную группы.

[0023] Фенил-C₂-C₄-алкинильная группа включает алкинильную группу, имеющую от 2 до 4 атомов углерода, связанную с фенильной группой, и ее примеры включают, например,
25 фенилэтинильную, фенил-1-пропинильную, фенил-2-пропинильную, фенил-1-бутинильную, фенил-2-бутинильную и фенил-3-бутинильную группы.

[0024] R⁵ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-
30 алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу или фенил-C₂-C₄-алкинильную группу. Их примеры включают группы, показанные в качестве примеров органических групп, представленных R^D и R¹. R⁵ предпочтительно представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу или C₂-C₆-алкинильную группу и более предпочтительно водород или C₁-C₆-
35 алкильную группу.

[0025] X представляет собой одинарную связь, -O- или -NR⁶-, а R⁶ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-

С₈-циклоалкильную группу, С₃-С₈-циклоалкил-С₁-С₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу, и их примеры включают группы, перечисленные в качестве примеров органических групп, представленных R^D и R¹. R⁶ предпочтительно представляет собой водород, С₁-С₆-алкильную группу, С₂-С₆-алкенильную группу или С₂-С₆-алкинильную группу и более предпочтительно водород. R⁵ и R⁶ могут образовывать кольцо.

[0026] R² представляет собой -OR⁷ или -NR⁸R⁹, предпочтительно -OR⁷. каждый из R⁷, R⁸ и R⁹ независимо представляет собой водород, С₁-С₆-алкильную группу, С₂-С₆-алкенильную группу, С₂-С₆-алкинильную группу, С₃-С₈-циклоалкильную группу, С₃-С₈-циклоалкил-С₁-С₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-С₁-С₄-алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу, и их примеры включают группы, перечисленные в качестве примеров органических групп, представленных R^D и R¹. R⁸ и R⁹ могут образовывать кольцо.

15

[0027] R⁷ предпочтительно представляет собой С₁-С₆-алкильную группу.

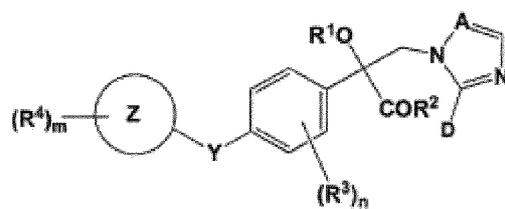
[0028] Алифатические группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ может иметь 1, 2, 3 или возможное максимальное число одинаковых или разных групп R^a, при этом R выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, С₁-С₄-алкоксигруппы и С₁-С₄-галогеналкоксигруппы. С₁-С₄-алкоксигруппа представляет собой линейную или разветвленную алкоксигруппу, имеющую от 1 до 4 атомов углерода, например, метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, втор-бутоксигруппа и трет-бутоксигруппа.

[0029] С₁-С₄-алкоксигруппа может быть замещена 1 или более галогеновыми группами в замещаемых положениях, и при наличии 2 или более галогеновых заместителей они могут быть одинаковыми или отличаться между собой.

[0030] E представляет собой фенильную группу или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N. E предпочтительно представляет собой фенильную группу. Предпочтительная форма, в которой E является фенильной группой, представлена следующей общей формулой (I').

[0031] [Хим. 3]

35



(I ')

R^3 представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу, C_1 - C_4 -алкоксигруппу, C_1 - C_4 -галогеналкоксигруппу, $-SOR^{10}$ или $-SF_5$. Примеры галогеновой группы, C_1 - C_4 -алкильной группы, C_1 - C_4 -галогеналкильной группы, C_1 - C_4 -алкоксигруппы и C_1 - C_4 -галогеналкоксигруппы включают группы, показанные в качестве примеров органических групп, представленных R^D , R^1 или R^A . R^3 предпочтительно представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу, C_1 - C_4 -алкоксигруппу, $-SOR^{10}$ или $-SF_5$ и более предпочтительно галогеновую группу, цианогруппу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу или C_1 - C_4 -алкоксигруппу. R^{10} представляет собой C_1 - C_4 -алкильную группу или C_1 - C_4 -галогеналкильную группу. Если E представляет собой фенильную группу, положение замещения R^3 находится в положении 2, 3, 5 или 6 и предпочтительно в положении 2. n равно 0, 1, 2 или 3, предпочтительно 1. Если E представляет собой 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N, положение замещения R^3 не содержит атома N в положениях 2, 3, 5 и 6 и предпочтительно находится в положении 2. В этом случае n равно 0, 1 или 2, предпочтительно 1.

[0032] R^4 представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, аминогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу, C_1 - C_4 -алкоксигруппу или C_1 - C_4 -алкоксигруппу, C_1 - C_4 -алкиламиногруппу, C_1 - C_4 -диалкиламиногруппу, C_1 - C_4 -алкилациламиногруппу, $-SOR^{10}$ или $-SF_5$ и примеры галогеновой группы, C_1 - C_4 -алкильной группы, C_1 - C_4 -галогеналкильной группы, C_1 - C_4 -алкоксигруппы, C_1 - C_4 -галогеналкоксигруппы и $-SOR^{10}$ включают в себя группы, перечисленные в качестве примеров органических групп, представленных R^D , R^1 и R^3 . R^4 предпочтительно представляет собой галогеновую группу, нитрогруппу, аминогруппу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу, C_1 - C_4 -алкоксигруппу, C_1 - C_4 -галогеналкоксигруппу, C_1 - C_4 -алкиламиногруппу, C_1 - C_4 -диалкиламиногруппу, C_1 - C_4 -алкилациламиногруппу, $-SOR^{10}$ или $-SF_5$, более предпочтительно галогеновую группу, C_1 - C_4 -алкильную группу, C_1 - C_4 -галогеналкильную группу, C_1 - C_4 -алкоксигруппу или C_1 - C_4 -галогеналкоксигруппу.

[0033] C_1 - C_4 -алкил аминогруппа представляет собой аминогруппу, в которой один из атомов водорода в аминогруппе замещен линейной или разветвленной алкильной группой, имеющей

от 1 до 4 атомов углерода, и примеры включают, например, метиламиногруппу, этиламиногруппу, н-пропиламиногруппу, изопропиламиногруппу и трет-бутиламиногруппу.

5 [0034] C₁-C₄-диалкиламиногруппа представляет собой аминогруппу, в которой оба из двух атомов водорода в аминогруппе замещен линейной или разветвленной алкильной группой, имеющей от 1 до 4 атомов углерода, и примеры включают, например, N,N-диметиламиногруппу, N,N-диэтиламиногруппу, N,N-ди-н-пропиламиногруппу, N,N-диизопропиламиногруппу и N,N-ди-трет-бутиламиногруппу.

10 [0035] C₁-C₄-алкилациламиногруппа представляет собой аминогруппу, в которой 1 или 2 атома водорода в аминогруппе замещены линейной или разветвленной алкилацильной группой, имеющей от 1 до 4 атомов углерода, и примеры включают, например, метилациламиногруппу, этилациламиногруппу, н-пропилациламиногруппу, изопропилациламиногруппу, трет-бутилациламиногруппу, N,N-диметилациламиногруппу, N,N-диэтилациламиногруппу, N,N-ди-н-пропилациламиногруппу, N,N-диизопропилациламиногруппу и N,N-ди-трет-бутилациламиногруппу.

20 [0036] Функциональные группы циклоалкильной или фенильной группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ или функциональная группа фенильной группы в R³ или R⁴ может иметь 1, 2, 3, 4, 5 или максимально возможное количество одинаковых или отличных групп R^bs. Каждый из R^b независимо выбран из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, C₁-C₄-алкильной группы, C₁-C₄-алкоксигруппы, C₁-C₄-галогеналкильной группы и C₁-C₄-галогеналкоксигруппы. Примеры галогеновой группы, C₁-C₄-алкильной группы, C₁-C₄-алкоксигруппы, C₁-C₄-галогеналкильной группы и C₁-C₄-галогеналкоксигруппы включают группы, показанные в качестве примеров органических групп, представленных R^D, R¹ или R^a.

30 [0037] Y представляет собой атом кислорода, -CH₂O-, -OCH₂-, -NH-, -N(-C₁-C₄-алкил)-, -N(-C₃-C₆-циклоалкил)- или -S(O)_p-, причем p равно 0, 1 или 2, который связан с любым положением фенильной группы, с которой связан (R³)_n, и предпочтительно представляет собой атом кислорода.

[0038] Y связан с орто-, мета-или пара-положением, предпочтительно мета-или пара-положением фенильной группы, замещенной R³.

35 [0039] Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, которая представляет собой фенильную или нафтильную группу, 5- или 6-членную ароматическую гетероциклическую группу, содержащую от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, или 9- или 10-членную ароматическую гетероциклическую группу, состоящую из двух колец. Z

предпочтительно представляет собой фенильную группу или 5- или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее от 1 до 3 гетероатомов, выбранных из N и S, и более предпочтительно фенильную группу.

5 [0040] Примеры 5- или 6-членной ароматической гетероциклической группы включают фурильную, пиразолильную, тиенильную, пиридильную, пиримидинильную, пиридазинильную, пиразинильную, пирролильную, имидазолильную, пиразолильную, тиазолильную, изотиазолильную, оксазолильную, изоксазолильную, оксадиазолильную, тиадиазолильную, триазолильную, тетразолильную и триазинильную группы.

10

[0041] Примеры 9- или 10-членных ароматических гетероциклических групп, состоящих из 2 колец, включают индолильную, изоиндолильную, бензимидазолильную, хинолинильную, изохинолинильную, хиноксалинильную, циннолильную, бензопиранильную и птеридинильную группы.

15

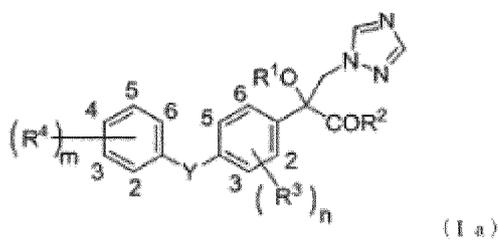
[0042] m R^4 связаны между собой в любом положении замещения, предпочтительно в положении 2, 3, 4 или 5. Если Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, то m равно 1, 2, 3, 4 или 5, а если Z представляет собой ароматическое гетероциклическое кольцо, то m равно 0, 1, 2, 3 или 4.

20

[0043] Особенно предпочтительные примеры производного азота (I) перечислены ниже в таблице 1. R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и Y в таблице 1 ниже соответствуют R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и Y в следующей химической формуле (Ia), соответственно. Далее каждое из конкретных производных азота, указанных каждым номером соединения, может называться «производным азота N» (N представляет собой номер соединения).

25

[Формула 4]



(I a)

30

[Таблица 1-1]

Compound No.	R ¹	R ²	(R ³) _n	(R ⁴) _m	Y
I-1	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-O-
I-2	H	OMe	2-Me	4-Cl	-O-
I-3	H	OMe	2-MeO	4-Cl	-O-
I-4	H	OMe	2-CN	4-Cl	-O-
I-5	H	OMe	H	4-Cl	-O-
I-6	H	OMe	3-Cl	4-Cl	-O-
I-7	H	OMe	2-OCF ₃	4-Cl	-O-
I-8	H	OMe	2-SF ₅	4-Cl	-O-
I-9	H	OMe	3-CF ₃	4-Cl	-O-
I-10	H	OMe	3-F	4-Cl	-O-
I-11	H	OMe	3-Br	4-Cl	-O-
I-12	H	OMe	2,3-Cl ₂	4-Cl	-O-
I-13	H	OMe	2,3-F ₂	4-Cl	-O-
I-14	H	OMe	2,5-Cl ₂	4-Cl	-O-
I-15	H	OMe	2,5-F ₂	4-Cl	-O-
I-16	H	OMe	2,6-Cl ₂	4-Cl	-O-
I-17	H	OMe	2,6-F ₂	4-Cl	-O-
I-18	H	OMe	2-Cl	4-MeO	-O-
I-19	H	OMe	2-Cl	2-Cl	-O-
I-20	H	OMe	2-Cl	3-Cl	-O-
I-21	H	OMe	2-Cl	2,4-Cl ₂	-O-
I-22	H	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-23	H	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-24	H	OMe	2-Cl	4-tBu	-O-
I-25	H	OMe	2-Cl	4-Br	-O-
I-26	H	OMe	2-Cl	4-F	-O-
I-27	H	OMe	2-Cl	3,4-Cl ₂	-O-
I-28	H	OMe	2-Cl	3,4-F ₂	-O-
I-29	H	OMe	2-Cl	3-F, 4-Cl	-O-
I-30	H	OMe	2-Cl	3-Cl, 4-F	-O-
I-31	H	OMe	2-Cl	2,4-F ₂	-O-
I-32	H	OMe	2-Cl	2-F, 4-Cl	-O-

[Таблица 1-2]

I-33	H	OMe	2-Cl	4-SF ₅	-0-
I-34	H	OMe	2-Cl	4-Me	-0-
I-35	H	OMe	2-Cl	4-CN	-0-
I-36	H	OMe	2-Cl	3, 4, 5-Cl ₃	-0-
I-37	H	OMe	2-Cl	3, 4, 5-F ₃	-0-
I-38	H	OMe	2-Cl	2, 4, 6-Cl ₃	-0-
I-39	H	OMe	2-Cl	2, 4, 6-F ₃	-0-
I-40	H	OMe	2-Cl	3-F, 4-Br	-0-
I-41	H	OMe	2-Cl	3-Br, 4-F	-0-
I-42	H	OMe	2-Cl	2, 4-Br ₂	-0-
I-43	H	OMe	2-Cl	2-F, 4-Br	-0-
I-44	H	OMe	2-Cl	3-Cl, 4-Br	-0-
I-45	H	OMe	2-Cl	3-Br, 4-Cl	-0-
I-46	H	OEt	2-Cl	4-Cl	-0-
I-47	H	O-iPr	2-Cl	4-Cl	-0-
I-48	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-Cl	4-Cl	-0-
I-49	H	O-nPr	2-Cl	4-Cl	-0-
I-50	H	O-nBu	2-Cl	4-Cl	-0-
I-51	H	O-iBu	2-Cl	4-Cl	-0-
I-52	H	O-tBu	2-Cl	4-Cl	-0-
I-53	H	O-C ₇ H ₁₂	2-Cl	4-Cl	-0-
I-54	H	NMe ₂	2-Cl	4-Cl	-0-
I-55	H	NMe ₂	2-Cl	4-Cl	-0-
I-56	H	NHEt	2-Cl	4-Cl	-0-
I-57	H	NEt ₂	2-Cl	4-Cl	-0-
I-58	H	NH-nPr	2-Cl	4-Cl	-0-
I-59	H	N(nPr) ₂	2-Cl	4-Cl	-0-
I-60	H	Морфолино-	2-Cl	4-Cl	-0-
I-61	H	Пиперидино-	2-Cl	4-Cl	-0-
I-62	H	Пирролидино-	2-Cl	4-Cl	-0-
I-63	Me	OMe	2-Cl	4-Cl	-0-
I-64	MeCO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-0-
I-65	tBuCO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-0-
I-66	PhCO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-0-
I-67	C ₂ H ₅ CO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-0-

[Таблица 1-3]

I-68	MeOCO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-O-
I-69	Me ₂ NCO-	OMe	2-Cl	4-Cl	-O-
I-70	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-S-
I-71	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-S(O)-
I-72	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-S(O) ₂ -
I-73	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-NH-
I-74	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-NMe-
I-75	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-N(CH ₂ Ph)-
I-76	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-CH ₂ O-
I-77	H	OMe	2-Cl	4-Cl	-OCH ₂ -
I-78	H	OEt	2-Cl	4-Br	-O-
I-79	H	O-iPr	2-Cl	4-Br	-O-
I-80	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-Cl	4-Br	-O-
I-81	H	O-nPr	2-Cl	4-Br	-O-
I-82	H	O-nBu	2-Cl	4-Br	-O-
I-83	H	O-tBu	2-Cl	4-Br	-O-
I-84	H	NMe ₂	2-Cl	4-Br	-O-
I-85	H	NEt ₂	2-Cl	4-Br	-O-
I-86	H	Морфолино-	2-Cl	4-Br	-O-
I-87	H	Пиперидино-	2-Cl	4-Br	-O-
I-88	Me	OMe	2-Cl	4-Br	-O-
I-89	MeCO-	OMe	2-Cl	4-Br	-O-
I-90	Me ₂ NCO-	OMe	2-Cl	4-Br	-O-
I-91	H	OMe	2-Cl	4-Br	-CH ₂ O-
I-92	H	OMe	2-Cl	4-Br	-OCH ₂ -
I-93	H	OEt	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-94	H	O-iPr	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-95	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-96	H	O-nPr	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-97	H	O-nBu	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-98	H	O-tBu	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-99	H	NMe ₂	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-100	H	NEt ₂	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-101	H	Морфолино-	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-102	H	Пиперидино-	2-Cl	4-CF ₃	-O-

[Таблица 1-4]

I-103	Me	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-104	MeCO-	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-105	Me ₂ NCO-	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-O-
I-106	H	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-CH ₂ O-
I-107	H	OMe	2-Cl	4-CF ₃	-OCH ₂ -
I-108	H	OEt	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-109	H	O-iPr	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-110	H	OCH ₂ (C ₃ H ₅)	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-111	H	O-nPr	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-112	H	O-nBu	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-113	H	O-tBu	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-114	H	NMe ₂	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-115	H	NEt ₂	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-116	H	Морфолино-	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-117	H	Пиперидино-	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-118	Me	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-119	MeCO-	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-120	Me ₂ NCO-	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-O-
I-121	H	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-CH ₂ O-
I-122a	H	OMe	2-Cl	4-OCF ₃	-OCH ₂ -
I-122	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-123	H	OMe	2-CF ₃	4-MeO	-O-
I-124	H	OMe	2-CF ₃	2-Cl	-O-
I-125	H	OMe	2-CF ₃	3-Cl	-O-
I-126	H	OMe	2-CF ₃	2, 4-Cl ₂	-O-
I-127	H	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-128	H	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-129	H	OMe	2-CF ₃	4-tBu	-O-
I-130	H	OMe	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-131	H	OMe	2-CF ₃	4-F	-O-
I-132	H	OMe	2-CF ₃	3, 4-Cl ₂	-O-
I-133	H	OMe	2-CF ₃	3, 4-F ₂	-O-
I-134	H	OMe	2-CF ₃	3-F, 4-Cl	-O-
I-135	H	OMe	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	-O-
I-136	H	OMe	2-CF ₃	2, 4-F ₂	-O-

[Таблица 1-5]

I-137	H	OMe	2-CF ₃	2-F, 4-Cl	-O-
I-138	H	OMe	2-CF ₃	4-SF ₂	-O-
I-139	H	OMe	2-CF ₃	4-Me	-O-
I-140	H	OMe	2-CF ₃	4-CN	-O-
I-141	H	OMe	2-CF ₃	3, 4, 5-Cl ₃	-O-
I-142	H	OMe	2-CF ₃	3, 4, 5-F ₃	-O-
I-143	H	OMe	2-CF ₃	2, 4, 6-Cl ₃	-O-
I-144	H	OMe	2-CF ₃	2, 4, 6-F ₃	-O-
I-145	H	OMe	2-CF ₃	3-F, 4-Br	-O-
I-146	H	OMe	2-CF ₃	3-Br, 4-F	-O-
I-147	H	OMe	2-CF ₃	2, 4-Br ₂	-O-
I-148	H	OMe	2-CF ₃	2-F, 4-Br	-O-
I-149	H	OMe	2-CF ₃	3-Cl, 4-Br	-O-
I-150	H	OMe	2-CF ₃	3-Br, 4-Cl	-O-
I-151	H	OEt	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-152	H	O-iPr	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-153	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-154	H	O-nPr	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-155	H	O-nBu	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-156	H	O-iBu	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-157	H	O-tBu	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-158	H	O-C ₂ H ₂₂	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-159	H	NMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-160	H	NMe ₂	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-161	H	NHEt	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-162	H	NEt ₂	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-163	H	NH-nPr	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-164	H	N(nPr) ₂	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-165	H	Морфолино-	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-166	H	Пиперидино-	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-167	H	Пирролидино-	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-168	Me	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-169	MeCO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-170	tBuCO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-171	PhCO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-

[Таблица 1-6]

I-172	C ₃ H ₇ CO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-173	MeOCO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-174	Me ₂ NCO-	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-O-
I-175	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-S-
I-176	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-S(O)-
I-177	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-S(O) ₂ -
I-178	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-NH-
I-179	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-NMe-
I-180	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-N(CH ₃ Ph)-
I-181	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-CH ₂ O-
I-182	H	OMe	2-CF ₃	4-Cl	-OCH ₂ -
I-183	H	OEt	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-184	H	O-iPr	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-185	H	OCH ₂ (C ₃ H ₇)	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-186	H	O-nPr	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-187	H	O-nBu	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-188	H	O-tBu	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-189	H	NMe ₂	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-190	H	NEt ₂	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-191	H	Морфолино-	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-192	H	Пиперидино-	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-193	Me	OMe	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-194	MeCO-	OMe	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-195	Me ₂ NCO-	OMe	2-CF ₃	4-Br	-O-
I-196	H	OMe	2-CF ₃	4-Br	-CH ₂ O-
I-197	H	OMe	2-CF ₃	4-Br	-OCH ₂ -
I-198	H	OEt	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-199	H	O-iPr	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-200	H	OCH ₂ (C ₃ H ₇)	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-201	H	O-nPr	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-202	H	O-nBu	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-203	H	O-tBu	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-204	H	NMe ₂	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-205	H	NEt ₂	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-206	H	Морфолино-	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-

[Таблица 1-7]

I-207	H	Пиперидино-	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-208	Me	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-209	MeCO-	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-210	Me ₂ NCO-	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-O-
I-211	H	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-CH ₂ O-
I-212	H	OMe	2-CF ₃	4-CF ₃	-OCH ₂ -
I-213	H	OBt	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-214	H	O-iPr	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-215	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-216	H	O-nPr	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-217	H	O-nBu	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-218	H	O-tBu	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-219	H	NMe ₂	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-220	H	NEt ₂	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-221	H	Морфолино-	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-222	H	Пиперидино-	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-223	Me	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-224	MeCO-	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-225	Me ₂ NCO-	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-O-
I-226	H	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-CH ₂ O-
I-227	H	OMe	2-CF ₃	4-OCF ₃	-OCH ₂ -
I-228	H	OMe	2-Br	4-Cl	-O-
I-229	H	OMe	2-Br	4-MeO	-O-
I-230	H	OMe	2-Br	2-Cl	-O-
I-231	H	OMe	2-Br	3-Cl	-O-
I-232	H	OMe	2-Br	2, 4-Cl ₂	-O-
I-233	H	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-234	H	OMe	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-235	H	OMe	2-Br	4-tBu	-O-
I-236	H	OMe	2-Br	4-Br	-O-
I-237	H	OMe	2-Br	4-F	-O-
I-238	H	OMe	2-Br	3, 4-Cl ₂	-O-
I-239	H	OMe	2-Br	3, 4-F ₂	-O-
I-240	H	OMe	2-Br	3-F, 4-Cl	-O-
I-241	H	OMe	2-Br	3-Cl, 4-F	-O-

[Таблица 1-8]

I-242	H	OMe	2-Br	2,4-F ₂	-0-
I-243	H	OMe	2-Br	2-F, 4-Cl	-0-
I-244	H	OMe	2-Br	4-SF ₅	-0-
I-245	H	OMe	2-Br	4-Me	-0-
I-246	H	OMe	2-Br	4-CN	-0-
I-247	H	OMe	2-Br	3,4,5-Cl ₃	-0-
I-248	H	OMe	2-Br	3,4,5-F ₃	-0-
I-249	H	OMe	2-Br	2,4,6-Cl ₃	-0-
I-250	H	OMe	2-Br	2,4,6-F ₃	-0-
I-251	H	OMe	2-Br	3-F, 4-Br	-0-
I-252	H	OMe	2-Br	3-Br, 4-F	-0-
I-253	H	OMe	2-Br	2,4-Br ₂	-0-
I-254	H	OMe	2-Br	2-F, 4-Br	-0-
I-255	H	OMe	2-Br	3-Cl, 4-Br	-0-
I-256	H	OMe	2-Br	3-Br, 4-Cl	-0-
I-257	H	OEt	2-Br	4-Cl	-0-
I-258	H	O-iPr	2-Br	4-Cl	-0-
I-259	H	OCH ₂ (C ₃ H ₅)	2-Br	4-Cl	-0-
I-260	H	O-nPr	2-Br	4-Cl	-0-
I-261	H	O-nBu	2-Br	4-Cl	-0-
I-262	H	O-iBu	2-Br	4-Cl	-0-
I-263	H	O-tBu	2-Br	4-Cl	-0-
I-264	H	O-C ₅ H ₁₁	2-Br	4-Cl	-0-
I-265	H	NMe	2-Br	4-Cl	-0-
I-266	H	NMe ₂	2-Br	4-Cl	-0-
I-267	H	NHEt	2-Br	4-Cl	-0-
I-268	H	NEt ₂	2-Br	4-Cl	-0-
I-269	H	NH-nPr	2-Br	4-Cl	-0-
I-270	H	N(nPr) ₂	2-Br	4-Cl	-0-
I-271	H	Морфолино-	2-Br	4-Cl	-0-
I-272	H	Пиперидино-	2-Br	4-Cl	-0-
I-273	H	Пирролидино-	2-Br	4-Cl	-0-
I-274	Me	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-0-
I-275	MeCO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-0-
I-276	tBuCO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-0-

[Таблица 1-9]

I-277	PhCO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-O-
I-278	C ₂ H ₅ CO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-O-
I-279	MeOCO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-O-
I-280	Me ₂ NCO-	OCH ₃	2-Br	4-Cl	-O-
I-281	H	OMe	2-Br	4-Cl	-S-
I-282	H	OMe	2-Br	4-Cl	-S(O)-
I-283	H	OMe	2-Br	4-Cl	-S(O) ₂ -
I-284	H	OMe	2-Br	4-Cl	-NH-
I-285	H	OMe	2-Br	4-Cl	-NMe-
I-286	H	OMe	2-Br	4-Cl	-N(CH ₂ Ph)-
I-287	H	OMe	2-Br	4-Cl	-CH ₂ O-
I-288	H	OMe	2-Br	4-Cl	-OCH ₂ -
I-289	H	OEt	2-Br	4-Br	-O-
I-290	H	O-iPr	2-Br	4-Br	-O-
I-291	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)	2-Br	4-Br	-O-
I-292	H	O-nPr	2-Br	4-Br	-O-
I-293	H	O-nBu	2-Br	4-Br	-O-
I-294	H	O-tBu	2-Br	4-Br	-O-
I-295	H	NMe ₂	2-Br	4-Br	-O-
I-296	H	NEt ₂	2-Br	4-Br	-O-
I-297	H	Морфолино-	2-Br	4-Br	-O-
I-298	H	Пиперидино-	2-Br	4-Br	-O-
I-299	Me	OMe	2-Br	4-Br	-O-
I-300	MeCO-	OMe	2-Br	4-Br	-O-
I-301	Me ₂ NCO-	OMe	2-Br	4-Br	-O-
I-302	H	OMe	2-Br	4-Br	-CH ₂ O-
I-303	H	OMe	2-Br	4-Br	-OCH ₂ -
I-304	H	OEt	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-305	H	O-iPr	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-306	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-307	H	O-nPr	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-308	H	O-nBu	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-309	H	O-tBu	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-310	H	NMe ₂	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-311	H	NEt ₂	2-Br	4-CF ₃	-O-

[Таблица 1-10]

I-312	H	Морфолино-	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-313	H	Пиперидино-	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-314	Me	OMe	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-315	MeCO-	OMe	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-316	Me ₂ NCO-	OMe	2-Br	4-CF ₃	-O-
I-317	H	OMe	2-Br	4-CF ₃	-CH ₂ O-
I-318	H	OMe	2-Br	4-CF ₃	-OCH ₂ -
I-319	H	OEt	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-320	H	O-iPr	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-321	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-322	H	O-nPr	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-323	H	O-nBu	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-324	H	O-tBu	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-325	H	NMe ₂	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-326	H	NEt ₂	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-327	H	Морфолино-	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-328	H	Пиперидино-	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-329	Me	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-330	MeCO-	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-331	Me ₂ NCO-	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-O-
I-332	H	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-CH ₂ O-
I-333	H	OMe	2-Br	4-OCF ₃	-OCH ₂ -
I-334	H	OMe	2-F	4-Cl	-O-
I-335	H	OMe	2-F	4-MeO	-O-
I-336	H	OMe	2-F	2-Cl	-O-
I-337	H	OMe	2-F	3-Cl	-O-
I-338	H	OMe	2-F	2,4-Cl ₂	-O-
I-339	H	OMe	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-340	H	OMe	2-F	4-CF ₃	-O-
I-341	H	OMe	2-F	4-tBu	-O-
I-342	H	OMe	2-F	4-Br	-O-
I-343	H	OMe	2-F	4-F	-O-
I-344	H	OMe	2-F	3,4-Cl ₂	-O-
I-345	H	OMe	2-F	3,4-F ₂	-O-
I-346	H	OMe	2-F	3-F, 4-Cl	-O-

[Таблица 1-11]

I-347	H	OMe	2-F	3-Cl, 4-F	-0-
I-348	H	OMe	2-F	2, 4-F ₂	-0-
I-349	H	OMe	2-F	2-F, 4-Cl	-0-
I-350	H	OMe	2-F	4-SF ₆	-0-
I-351	H	OMe	2-F	4-Me	-0-
I-352	H	OMe	2-F	4-CN	-0-
I-353	H	OMe	2-F	3, 4, 5-Cl ₃	-0-
I-354	H	OMe	2-F	3, 4, 5-F ₃	-0-
I-355	H	OMe	2-F	2, 4, 6-Cl ₃	-0-
I-356	H	OMe	2-F	2, 4, 6-F ₃	-0-
I-357	H	OMe	2-F	3-F, 4-Br	-0-
I-358	H	OMe	2-F	3-Br, 4-F	-0-
I-359	H	OMe	2-F	2, 4-Br ₂	-0-
I-360	H	OMe	2-F	2-F, 4-Br	-0-
I-361	H	OMe	2-F	3-Cl, 4-Br	-0-
I-362	H	OMe	2-F	3-Br, 4-Cl	-0-
I-363	H	OEt	2-F	4-Cl	-0-
I-364	H	O-iPr	2-F	4-Cl	-0-
I-365	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)	2-F	4-Cl	-0-
I-366	H	O-nPr	2-F	4-Cl	-0-
I-367	H	O-nBu	2-F	4-Cl	-0-
I-368	H	O-iBu	2-F	4-Cl	-0-
I-369	H	O-tBu	2-F	4-Cl	-0-
I-370	H	O-C ₆ H ₁₃	2-F	4-Cl	-0-
I-371	H	NHMe	2-F	4-Cl	-0-
I-372	H	NMe ₂	2-F	4-Cl	-0-
I-373	H	NHEt	2-F	4-Cl	-0-
I-374	H	NEt ₃	2-F	4-Cl	-0-
I-375	H	NH-nPr	2-F	4-Cl	-0-
I-376	H	N(nPr) ₂	2-F	4-Cl	-0-
I-377	H	Морфолино-	2-F	4-Cl	-0-
I-378	H	Пиперидино-	2-F	4-Cl	-0-
I-379	H	Пирролидино-	2-F	4-Cl	-0-
I-380	Me	OCH ₃	2-F	4-Cl	-0-
I-381	MeCO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-0-

[Таблица 1-12]

I-382	tBuCO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-O-
I-383	PhCO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-O-
I-384	C ₂ H ₅ CO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-O-
I-385	MeOCO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-O-
I-386	Me ₂ NCO-	OCH ₃	2-F	4-Cl	-O-
I-387	H	OMe	2-F	4-Cl	-S-
I-388	H	OMe	2-F	4-Cl	-S(O)-
I-389	H	OMe	2-F	4-Cl	-S(O) ₂ -
I-390	H	OMe	2-F	4-Cl	-NH-
I-391	H	OMe	2-F	4-Cl	-NMe-
I-392	H	OMe	2-F	4-Cl	-N(CH ₂ Ph)-
I-393	H	OMe	2-F	4-Cl	-CH ₂ O-
I-394	H	OMe	2-F	4-Cl	-OCH ₂ -
I-395	H	OEt	2-F	4-Br	-O-
I-396	H	O-iPr	2-F	4-Br	-O-
I-397	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-F	4-Br	-O-
I-398	H	O-nPr	2-F	4-Br	-O-
I-399	H	O-nBu	2-F	4-Br	-O-
I-400	H	O-tBu	2-F	4-Br	-O-
I-401	H	NMe ₂	2-F	4-Br	-O-
I-402	H	NEt ₂	2-F	4-Br	-O-
I-403	H	Морфолино-	2-F	4-Br	-O-
I-404	H	Пиперидино-	2-F	4-Br	-O-
I-405	Me	OMe	2-F	4-Br	-O-
I-406	MeCO-	OMe	2-F	4-Br	-O-
I-407	Me ₂ NCO-	OMe	2-F	4-Br	-O-
I-408	H	OMe	2-F	4-Br	-CH ₂ O-
I-409	H	OMe	2-F	4-Br	-OCH ₂ -
I-410	H	OEt	2-F	4-CF ₃	-O-
I-411	H	O-iPr	2-F	4-CF ₃	-O-
I-412	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-F	4-CF ₃	-O-
I-413	H	O-nPr	2-F	4-CF ₃	-O-
I-414	H	O-nBu	2-F	4-CF ₃	-O-
I-415	H	O-tBu	2-F	4-CF ₃	-O-
I-416	H	NMe ₂	2-F	4-CF ₃	-O-

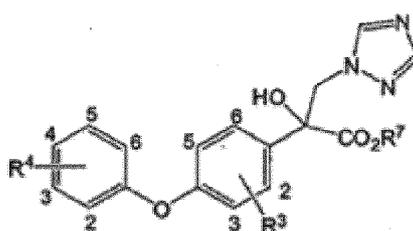
[Таблица 1-13]

I-417	H	NEt ₂	2-F	4-CF ₃	-O-
I-418	H	Морфолино-	2-F	4-CF ₃	-O-
I-419	H	Пиперидино-	2-F	4-CF ₃	-O-
I-420	Me	OMe	2-F	4-CF ₃	-O-
I-421	MeCO-	OMe	2-F	4-CF ₃	-O-
I-422	Me ₂ NCO-	OMe	2-F	4-CF ₃	-O-
I-423	H	OMe	2-F	4-CF ₃	-CH ₂ O-
I-424	H	OMe	2-F	4-CF ₃	-OCH ₂ -
I-425	H	OEt	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-426	H	O-iPr	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-427	H	OCH ₂ (C ₂ H ₅)	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-428	H	O-nPr	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-429	H	O-nBu	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-430	H	O-tBu	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-431	H	NMe ₂	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-432	H	NEt ₂	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-433	H	Морфолино-	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-434	H	Пиперидино-	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-435	Me	OMe	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-436	MeCO-	OMe	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-437	Me ₂ NCO-	OMe	2-F	4-OCF ₃	-O-
I-438	H	OMe	2-F	4-OCF ₃	-CH ₂ O-
I-439	H	OMe	2-F	4-OCF ₃	-OCH ₂ -

[0044] Другой пример особенно предпочтительного производного азола (I) представлен следующей химической формулой (Ib).

5

[0045] [Химическая формула 5]



(I b)

10 В формуле (Ib) R⁷ представляет собой метил, этил, н-пропил, изопропил или трет-бутил. В формуле (Ib) R³ представляет собой 2-метил, 2-изопропил, 2-трет-бутил, 2-метокси, 2-трифторметил, 2-трихлорметил, 2-фтор, 2-хлор, 2-бром, 2,6-дихлор или 2,3-дихлор. В формуле (Ib) R⁴ представляет собой водород, 2-хлор, 3-хлор, 4-хлор, 2,4-дихлор, 2,3-дихлор, 2,4,6-трихлор, 4-трифторметил, 4-трифторметокси, 4-фенил или 4-фенокси. Номера префикса каждой

органической группы, показанные в описании R^3 и R^4 , указывают положение связывания в бензольном кольце.

5 [0046] Среди них R^7 в формуле (Ib) предпочтительно представляет собой метил, этил, н-пропил и изопропил, R^3 предпочтительно представляет собой 2-трифторметил, 2-трихлорметил, 2-фтор, 2-хлор и 2-бром, а R^4 предпочтительно представляет собой 2-хлор, 3-хлор, 4-хлор, 2,4-дихлор, 4-трифторметил и 4-трифторметокси.

10 [0047] [2. Способ получения производного азола]

Производное (I) азола можно получить любым из трех описанных ниже способов. В описанных ниже способах 1-3 получения производных азола для удобства объяснения описана конкретная форма производного азола (I), но другие формы также могут быть получены путем замены исходных материалов.

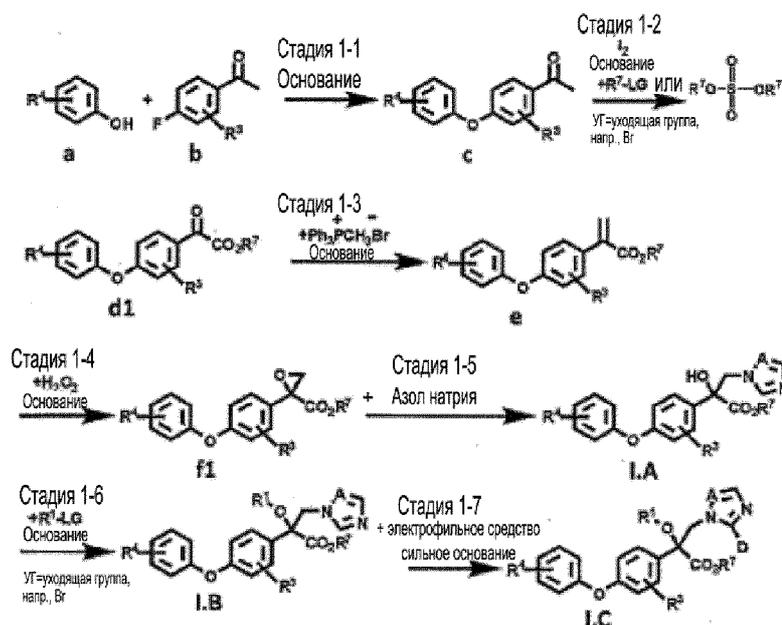
15 [0048] R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , A и D в приведенной ниже схеме соответствуют R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , A и D в вышеописанной общей формуле (I), соответственно.

20 [0049] (1) Способ 1 получения производного азола

Производное (I) азола может быть получено из соединения, полученного известным способом, в соответствии с общей схемой 1, приведенной ниже.

25 [0050] Общая схема 1

[0051] [Химическая формула 6]



(Стадия 1-1) В способе получения 1 на приведенной выше схеме 1 фенольное соединение, представленное общей формулой а (далее именуется «фенол а») вводят в реакцию с ацетофеноновым соединением, представленным общей формулой б (далее именуется «ацетофенон б») в присутствии основания с получением соединения, представленного общей формулой с (далее именуется «соединение с»).

[0052] (Стадия 1-2) Полученное соединение с вводят в реакцию с йодом в подходящем растворителе, таком как диметилсульфоксид (DMSO). К нему добавляют подходящее основание, такое как карбонат, и дополнительно вводят в реакцию с диалкилсульфатом ($R^7OS(=O)_2OR^7$) или R^7-LG с получением соединения, представленного общей формулой d1 (далее именуется «соединение d1»). К карбонату относятся карбонат натрия, карбонат калия, карбонат цезия и карбонат лития и предпочтительно карбонат калия. LG представляет собой нуклеофильно замещаемую уходящую группу, например уходящую группу, выбранную из галогеновой группы, алкилсульфонилоксигруппы и арилсульфонилоксигруппы, предпочтительно галогеновой группы, более предпочтительно бромной группы или йодной группы.

[0053] (Стадия 1-3) Соединение d1 вводят в реакцию с галогенидом метилтрифенилфосфония в присутствии любого растворителя, такого как толуол, тетрагидрофуран (THF) или DMSO, в присутствии основания, такого как трет-бутоксид калия или гидрид натрия, с получением акрилатного соединения, представленного общей формулой е (далее именуется «акрилат е»).

25

[0054] (Стадия 1-4) Акрилат e вводят в реакцию с водным раствором пероксида водорода или его смеси с карбонатом натрия или мочевины в растворителе (метаноле или ацетонитриле) и предпочтительно в присутствии основания, такого как бикарбонат натрия или карбонат калия, с получением эпоксидного соединения, представленного общей формулой f1 (далее именуется «эпоксидное соединение f1»).

[0055] (Стадия 1-5) Эпоксидное соединение f1 вводят в реакцию с азолом натрия в органическом растворителе, предпочтительно диметилформамиде (DMF), с получением соединения, представленного общей формулой I.A, в котором R^1 представляет собой водород, D представляет собой водород, R^2 представляет собой $-OR^7$, Z и E представляют собой фенил, а Y представляет собой O (далее именуемое соединением I.A).

[0056] (Стадия 1-6) При необходимости соединение I.A впоследствии вводят в реакцию с R^1 -LG в присутствии основания, такого как NaH, предпочтительно в приемлемом растворителе, таком как THF, с получением соединения, представленного общей формулой I.B (далее именуемого соединением I.B). LG представляет собой нуклеофильно замещаемую уходящую группу, например уходящую группу, выбранную из галогеновых групп, алкилсульфонилоксигрупп и арилсульфонилоксигрупп, предпочтительно бромной группы или йодной группы.

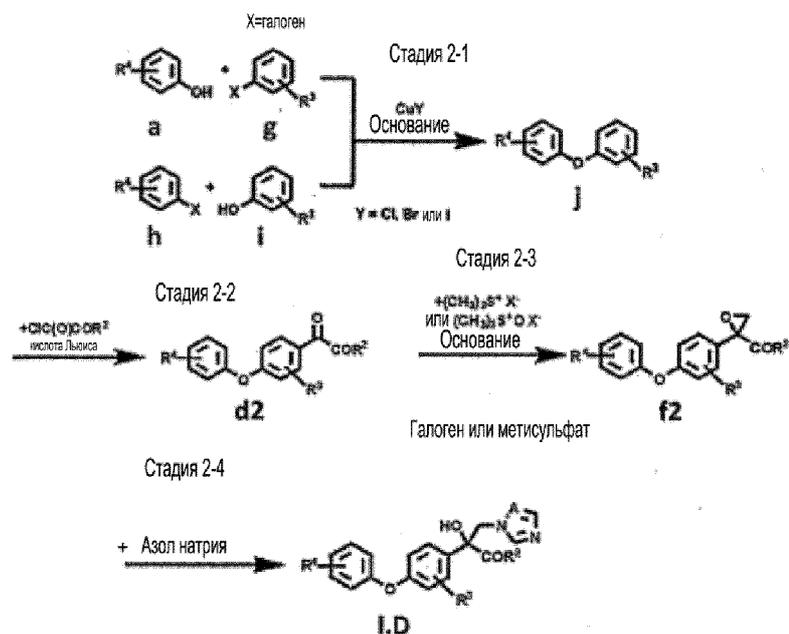
[0057] (Стадия 1-7) Соединение I.B вводят в реакцию с электрофильным средством, таким как сера, йод, монохлорид йода и дибромтетрафторэтан, в присутствии сильного основания, такого как бутиллитий, диизопропиламид лития и гексааметилдисилазид калия, с получением соединения, представленного общей формулой I.C.

[0058] (2) Способ 2 получения производного азола

Производное (I) азола по настоящему изобретению может быть получено из соединения, полученного известным способом, в соответствии с общей схемой 2, приведенной ниже.

[0059] Общая схема 2

[0060] [Химическая формула 7]



(Стадия 2-1) В способе получения 2 фенол а и галогенбензольное соединение, представленное общей формулой g, или фенольное соединение, представленное общей формулой i и галогенбензольное соединение, представленное общей формулой h на общей схеме 2 вводят в реакцию при необходимости в присутствии CuY и предпочтительно в присутствии основания с получением соединения, представленного общей формулой j (далее именуемого «соединение j»). В данном случае Y представляет собой хлорную группу, бромную группу или йодную группу.

10

[0061] (Стадия 2-2) Соединение j вводят в реакцию с хлоргликозилатом алкила в присутствии кислоты Льюиса, предпочтительно хлорида алюминия или хлорида железа (III), с получением соединения d2. Соединение d2 может быть получено посредством способа, аналогичного d1 в способе получения 1, и может обеспечивать получение соединения I.A, I.B или I.C таким же образом, как d1 в способе получения 1.

15

[0062] (Стадия 2-3) Соединение d2 вводят в реакцию с соединением, выбранным из галогенида триметилсульфония, метилсульфата триметилсульфония, галогенида триметилсульфоксония и метилсульфата триметилсульфоксония в присутствии основания, такого как гидрид натрия, трет-бутоксид натрия или карбонат цезия, с получением эпоксидного соединения f2.

20

[0063] (Стадия 2-4) Эпоксидное соединение f2 вводят в реакцию с азолом натрия в присутствии органического растворителя, такого как DMF, с получением соединения I.D, в котором R¹ в общей формуле (I) представляет собой водород, D представляет собой водород, Z

25

и E представляют собой фенил, а Y представляет собой O. Соединение I.D может быть дополнительно дериватизировано.

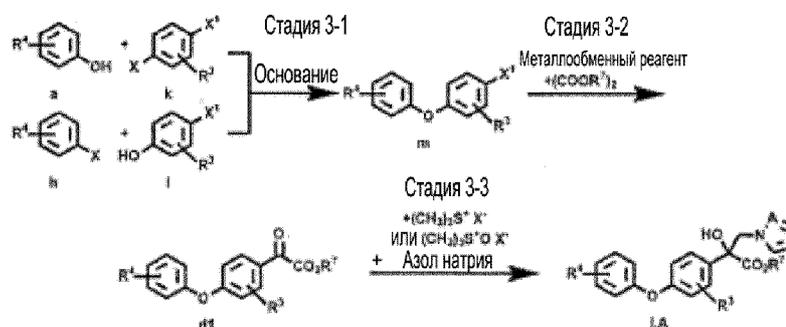
[0064] (3) Способ 3 получения производного азола

5

В качестве альтернативы производное (I) азола по настоящему изобретению может быть получено из соединений, полученных посредством известного способа в соответствии с общей схемой 3, приведенной ниже.

10 [0065] Общая схема 3

[0066] [Химическая формула 8]



15

(Стадия 3-1) В способе получения 3 в общей схеме 3 фенол и галогенбензольное соединение, представленное общей формулой k, или фенольное соединение, представленное общей формулой l, и галогенбензольное соединение, представленное общей формулой h, вводят в реакцию с получением соединения, представленного общей формулой m (далее именуется «соединение m»). В данном случае X¹ представляет собой бромную группу или йодную группу.

20

[0067] (Стадия 3-2) Соединение M превращают в металлоорганический реагент путем реакции с металлообменным реагентом, таким как бутиллитий или хлорид изопропилмагния, с последующей реакцией с диалкилоксалатом (COOR')₂ с получением соединения d1. Соединение d1 может быть получено посредством способа, аналогичного d2 в способе получения 1 или 2, и может обеспечивать получение соединения I.A, I.B, I.C или I.D таким же образом, как в способе получения 1 или 2.

25

30

[0068] (Стадия 3-3) Соединение d1 вводят в реакцию с галогенидом триметилсульфония, метилсульфатом триметилсульфония, галогенидом триметилсульфоксония или метилсульфатом

триметилсульфония в присутствии азота натрия с получением соединения I.A, представленного общей формулой (I), в котором R¹ представляет собой водород, D представляет собой водород, R² представляет собой –OR⁷, Z и E представляют собой фенил, а Y представляет собой O. Соединение I.A можно дополнительно дериватизировать.

5

[0069] В вышеуказанных способах получения 1-3 для удобства объяснения описана конкретная форма производного азота (I), но без ограничения ею. Например, в способах получения 1-3 описана форма, в которой Z в общей формуле (I) представляет собой фенильную группу, но Z не ограничивается фенильной группой. Например, можно получить производное (I) азота, в котором Z отличается от фенильной группы, посредством того же способа, что и в способах получения 1-3, с использованием в качестве исходного материала доступного в продаже соединения, в котором гидроксильная группа и предпочтительный R⁴ связаны с нафтильной группой, 5- или 6-членным ароматическим гетероциклическим кольцом, содержащим от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, или 9- или 10-членным ароматическим гетероциклическим кольцом, состоящим из двух колец вместо фенола.

10

15

[0070] В способах получения 1-3 описана форма, в которой E в общей формуле (I) представляет собой фенильную группу, но E не ограничивается фенильной группой. Например, можно получить производное (I) азота, в котором E отличается от фенильной группы, посредством того же способа, что и в способе получения 1, с использованием соединения, в котором кетогруппа, фторгруппа и предпочтительный R³ связаны с 6-членным ароматическим гетероциклическим кольцом, содержащим 1 или 2 атома N вместо ацетофенона b.

20

[0071] Также можно получать производное (I) азота, в котором E отличается от фенильной группы, посредством следующего способа, как в способе получения 2.

25

(a) Соединение, в котором хлорная группа, бромная группа или йодная группа и предпочтительный R³ связаны с 6-членным гетероароматическим кольцом, содержащим 1 или 2 атома N, вместо галогенбензольного соединения, представленного общей формулой g.

30

(b) Соединение, в котором гидроксильная группа и предпочтительный R³ связаны с 6-членным ароматическим гетероциклическим кольцом, содержащим 1 или 2 атома N, вместо фенольного соединения, представленного общей формулой i.

35

[0072] Также можно получать производное (I) азота, в котором E отличается от фенильной группы, посредством следующего способа, как в способе получения 3.

(с) Соединение, в котором первая галогенная группа, выбранная из хлорной группы, бромной группы и йодной группы, и вторая галогенная группа, выбранная из бромной группы и йодной группы, и предпочтительный R^3 связаны с 6-членным ароматическим гетероциклическим кольцом, содержащим 1 или 2 атома N, вместо галогенбензольного соединения, представленного общей формулой k.

(d) Соединение, в котором бромная группа или йодная группа, гидроксильная группа и предпочтительный R^3 связаны с 6-членным гетероароматическим кольцом, содержащим 1 или 2 атома N, вместо фенольного соединения, представленного общей формулой l.

10

[0073] В способах получения 1-3 Y в общей формуле (I) представляет собой атом кислорода, но Y не ограничивается атомом кислорода. Производное (I) азола, в котором Y отличается от атома кислорода, можно получить посредством того же способа, что и в способах получения 1-3, с использованием в качестве исходного материала, например, коммерчески доступное соединение, в котором $-CH_2OH$, $-OCH_3$, $-NH_2$, $-N(-C_1-C_4\text{-алкил})H$, $-N(-C_3-C_6\text{-циклоалкил})H$ или $-S(O)_pH$ связаны с соединением, соответствующим Z в общей формуле (I) (т. е. бензолом, нафталином, пирролом, пиридином, пиримидином, тиофеном и т. д., с которым связан R^4) вместо фенола a.

15

20 [0074] [3. Другие активные ингредиенты]

Примеры другого активного ингредиента, содержащегося с производным (I) азола, включают известные активные ингредиенты в фунгицидах, инсектицидах, митицидах, нематицидах и регуляторах роста растений, среди которых предпочтительными являются известные активные ингредиенты в фунгицидах, инсектицидах и регуляторах роста растений.

25

[0075] (1) Активные ингредиенты фунгицида

К известным активным ингредиентам, содержащимся в фунгицидах, относятся ингибиторы синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот, ингибиторы митотического деления/клеточного деления, ингибиторы дыхания, ингибиторы биосинтеза аминокислот/белков, ингибиторы передачи сигнала, ингибиторы биосинтеза липидов или транспортировки/структуры клеточной мембраны или функции, ингибиторы биосинтеза стерола клеточной мембраны, ингибиторы биосинтеза клеточной стенки, ингибиторы биосинтеза меланина, индукторы устойчивости растения-хозяина и многоцентровые фунгициды.

35

[0076] В частности, ингибитор синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот может включать в себя по меньшей мере один ингибитор, выбранный, например, из беналаксила, беналаксила-

М, фуралаксила, овечной расы, бупиримата, диметиримола, этиримола, октилинона, металаксила, металаксила-М, оксадиаксила и гимексазола.

5 [0077] Ингибитор митотического разделения/клеточного разделения может включать в себя по меньшей мере один ингибитор, выбранный, например, из беномила, карбендазима, фуберидазола, тиабендазола, тиофаната, тиофанат-метила, диэтофенкарба, зоксамида, этабоксама, пенцикурона, флупиколида, фенамакрила, метрафенона и пириофенона.

10 [0078] Ингибитор дыхания может включать в себя по меньшей мере один, выбранный например, из следующих: толфенпирад, дифлуметорим, феназахин, пидифлуметофен, фенфурам, карбоксин, оксикарбоксин, беноданил, флутоланил, мепронил, изофетамид, бензовиндифлупир, биксафен, флуиндапир, флуксапироксад, фураметпир, инпирфлуксам, изопиразам, пенфлуфен, пентиопирад, седаксан, изофлуципрам, боскалид, флуопирам, тифлузамид, пиразифлумид, пирибенкарб, флуокастробин, фенамидон, мандестробин, 15 азоксистробин, кумоксистробин, энокастробин, флуфеноксистробин, пикоксистробин, пираоксистробин, триклопирикарб, фенаминстробин, метминостробин, орисастробин, крезоксим-метил, трифлуксистробин, циазофамид, амисульбром, фенпикоксамид, флорилпикоксамид, бинапакрил, мептилдинокап, динокап, флуазинам, ацетат трифенилолова, хлорид трифенилолова, гидроксид трифенилолова, силтиофам, аметоктрадин, метилтетрапрол, 20 пирапропоин и инпирфлуксам.

[0079] Ингибитор биосинтеза аминокислот/белков может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из следующих: ципродинил, мепанипирим, пириметанил, бластицидин, касугамицин, стрептомицин и окситетрациклин.

25

[0080] Ингибитор передачи сигнала может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из следующих: хиноксифен, проквиназид, хлозолинат, диметахлон, фенпиклонил, флудиоксонил, ипродион, процимидон и винклозолин.

30 [0081] Ингибитор биосинтеза липидов или транспортировки/структуры клеточной мембраны или функции может включать в себя по меньшей мере один ингибитор, выбранный, например, из изопропиолана, эдифенфоса, ипробенфоса (IBP), пиразофоса, бифенила, хлоронеба, дихлорана, хинотена (PCNB), текназена (TCNB), толклофос-метила, этридиазола, протиокарба, пропамокарба, натамицина, оксатиапипролина и флуоксапипролина.

35

[0082] Ингибитор биосинтеза стерола клеточной мембраны может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из имазадила, окспоконазола, пефуразоата, прохлоразы, трифлумизола, трифорина, пирифенокса, пиризоксазола, фенаримола, нуаримола,

азаконазола, битертанола, бромуконазола, ципроконазола, дифеноконазола, диниконазола, эпоксиконазола, этаконазола, фенбуконазола, флуквинконазола, флусилазола, флутриафола, гексаконазола, имибенконазола, метконазола, ипконазола, миклбутанила, пенконазола, пропиконазола, симеконазола, тебуконазола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, мефентрифлуконазола, протиоконазола, тридеморфа, фенпропиморфа, фенпропидина, пипералина, спироксамина, фенпиразамина, фенгексамида, нафтифина, тербинафина, пирибутикарба и ипфентрифлуконазола.

[0083] Ингибитор биосинтеза клеточной стенки может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из следующих: полиоксин, диметоморф, флуморф, пириморф, мандипропамид, бентиаваликарб, ипроваликарб и валифеналат.

[0084] Ингибитор биосинтеза меланина может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из фталида, трициклазола, пирокирона, карпропамида, диклоцимета, феноксанила и толпрокарба.

[0085] Индуктор устойчивости растения-хозяина может содержать по меньшей мере один, выбранный, например, из ацибензолар-S-метила, пробеназола, тиадинила, ламинарина, изотианила, ламинарина, фостила-A1, фосфорной кислоты и фосфонатов.

[0086] Многоцентровый фунгицид может включать в себя по меньшей мере один фунгицид, выбранный, например, из цимоксанила, теклофталама, триазоксида, флусульфамида, дикломезина, цифлуфенамида, додина, флутианила, феримзона, тебуфлохина, пикарбутразокса, валидамицина, минерального масла, пищевой соды, карбоната калия, меди и соединений меди, серы, фербама, манкоцеба, манеба, метрирама, пропинеба, тирама, цинеба, зирама, каптана, каптафола, фолпета, хлороталонила (TPN), дитианона, иминоктадина ацетата, иминоктадина альбезилата, анилазина, дитианона, фторимида, метасульфокарба, флорилпикоксамида, флуопирамида, ипфлуфеноксина, хинометионата, пиридахлометила, аминокпирифена, дихлобентиазокса, хинофумелина и дипиметитрона.

[0087] (2) Активные ингредиенты инсектицида

Примеры известных активных ингредиентов, содержащихся в инсектицидах, включают в себя модуляторы никотиновых ацетилхолиновых рецепторов, модуляторы натриевых каналов, модуляторы риаинодиновых рецепторов, ингибиторы ацетилхолинэстеразы, разобщающие средства окислительного фосфорилирования и ингибиторы комплекса I митохондриальной цепи транспорта электронов.

[0088] В частности, модуляторы никотинового ацетилхолинового рецептора могут, например, включать в себя по меньшей мере одно из следующего: ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитифенпиром, тиаклоприд, тиаметоксам, сульфоксафор, флупирадифулон и трифлуметоприм.

5

[0089] Модулятор натриевых каналов может представлять собой по меньшей мере одно пиретроидное соединение, выбранное, например, из акринатрина, аллтрина, ципертрина, бифентрина, циклопротрина, цигалотрина, ципертрина, дельтамефлутрина, эсфенвалерата, этофенпрокса, фенпропарина, фенвалерата, флубромцитрината, флуцитрината, флувалината, галофенпрокса, цигалотрина, метофлутрина, момфтортрина, перметрина, профлутрина, тefлутрина, тралометрина, цифлутрина, бифентрина, имипротрина, пиретрина, цифениотрина, хлорпраллетрина, эpsilon-метофлутрина и эpsilon-мофтортрина.

10

[0090] Модулятор риадинового рецептора может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из хлорантранилипрола, циантранилипрола, флубендиамида и цигалодиамида.

15

[0091] Ингибитор ацетилхолинэстеразы может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из ацефата, азинофос-метила, кадзафоса, хлорэтоксифоса, хлорфенвинфоса, хлорпирифоса, цианофоса, деметон-S-метила, диазинона, дихлорвоса (DDVP), дикротифоса, диметоата, дисульфотона, этиона, этопрофоса, EPN, фенамифоса, фенитротриона (MEP), фентиона (MPP), фостиазата, имициафоса, изофенфоса, изоксатиона, малатиона, метамидофоса, метидатиона, мевинфоса, монокротифоса, омеметоата, оксидеметон-метила, паратиона, паратион-метила, фентоата, фората, фосалона, фосмета, фосфамидона, фоксима, пиримифосметила, профенофоса, протиофоса, пиралофоса, пиридафентиона, хиналфоса, тебупиримфоса, тербуфоса, триазофоса, трихлорфоса (DEP), аланикарба, алдикарба, бенфуракарба, карбарила (NAC), карбофурана, карбосульфана, картапа, феноксикарба (BPMC), форметаната, изопрокарба (MIPC), метиокарба, метомила, оксамила, пиримикарба, тиодикарба, ХМС, бендиокарба, этиофенкарба, фенобукарба, фенотиокарба, фурагиокарба, метолкарба и ксиллкарба.

20

25

30

[0092] Разобщающее средство окислительного фосфорилирования может включать в себя по меньшей мере одно, выбранное, например, из хлорфенапира, DNOC и сульфлурамида.

[0093] Ингибитор I цепи митохондриального транспорта электронов может включать в себя по меньшей мере один, выбранный, например, из тебуфенпирада, толфенпирада, феназахина, фенпироксимата, пиридабена, пиримидифена и ротенона.

35

[0094] (3) Активные ингредиенты регулятора роста растений

Активный ингредиент регулятора роста растений содержит по меньшей мере один ингредиент, выбранный, например, из аминоксиксидвинилглицина, хлормеквата, хлорпрофама, цикланилида, дикеглака, даминозида, этефона, флурпримидола, флуметралина, форхлорфенурина, гибберелина, гидразина малеата, мепиквата хлорида, метилциклопропена, бензиламинопурина, паклобутразола, прогексадиона, тидиазурона, трибутилфосфоротритиоата, тринекса-этила и уникаконазола.

10 [0095] (4) Активные ингредиенты митицида

Примеры известных активных ингредиентов, содержащихся в митицидах, включают ацехиноцил, амидофлумет, амитраз, азоциклотин, бифеназат, бромпропилат, хлорфененон, хиномсат, фенизобромолат, бензоксимат, клофентезин, циенпирафен, цифлуметофен, цигексатин, дифлоvidaзин, диенохлор, этоксазол, феназахин, оксид фенбутатина, фенпироксимат, фенотиокарб, флауакрипирим, гекситиазокс, пропаргит (BAPS), пифлубумид, пиридабен, пиримидифен, спиродиклофен, спиромезифен, тебуфенпирад, тетрадифон, ацинонапир, а также смешанные масла.

20 [0096] (5) Активные ингредиенты нематицида

Примеры известных активных ингредиентов, содержащихся в нематицидах (нематицидном активном ингредиенте), включают в себя D-D (1,3-дихлорпропен), DCIP (дихлордиизопропиловый эфир), метилизотиоцианат, соль карбам-натрий, кадзафос, фостиазат, имафос, морантелтарtrat, левамизола гидрохлорид, немадетин и тиоксазафен.

[0097] [4. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид]

Поскольку производное (I) азола содержит имидазолильную группу или 1,2,4-триазолильную группу, оно образует кислотно-аддитивные соли неорганических кислот или органических кислот или металлический комплекс. Таким образом, его можно применять в качестве активного ингредиента в сельскохозяйственных или садоводческих фунгицидах вместе с другими активными ингредиентами в качестве части кислотно-аддитивных солей и комплексов металлов.

35

[0098] (1) Эффект в борьбе болезнями растений

Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему варианту осуществления проявляет эффект в борьбе против широкого спектра болезней растений.

[0099] Примеры соответствующих заболеваний приведены ниже. Следует отметить, что в
5 скобках после каждого названия болезни указан (-ы) основной патогенный грибок (грибки),
который (-ые) вызывает (-ют) заболевание. Их примеры включают следующие: азиатская соевая
ржавчина (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), бурая пятнистость сои (*Zymoseptria*
glycines), пурпурная пятнистость сои (*Cercospora kikuchii*), альтернариоз листьев сои (*Alternaria*
sp.), антракноз сои (*Collectotrichum truncatum*), селенофомозная пятнистость сои (*Cercospora*
10 *sojina*), корневая гниль сои (*Rhizoctonia solani*), фитофтороз листьев сои (*Rhizoctonia solani*),
гниль бобов и стеблей сои (*Diaporthe phaseolorum*), фитофтора корневая и стеблевая гниль сои
(*Phytophthora sojae*), антракноз фасоли (*Collectotrichum lindemutianum*), пятнистость
листьев/язвы стебля рапса (*Leptosphaeria maculans*, *Leptosphaeria biglobosa*), светлая
пятнистость рапса (*Pyrenopeziza brassicae*), кила рапса (*Plasmodiophora brassicae*), вертициллез
15 рапса (*Verticillium longisporum*), черная пятнистость рапса (*Alternaria spp*), пирикулярноз риса
(*Pyricularia oryzae*), бурая пятнистость риса (*Cochliobolus myabeanus*), бактериальный ожог
листьев риса (*Xanthomonas oryzae*), ризоктониоз стеблей риса (*Rhizoctonia solani*), стеблевая
гниль риса (*Helminthosporium sigmodeen*), «баканаэ» риса (*Fusarium fujikuroi*), белая гниль
всходов риса (*Pythium aphanidermatum*), выпревание риса (*Pythium graminicola*), настоящая
20 мучнистая роса пшеницы (*Erysiphe graminis f.sp hordei*), ржавчина стеблей ячменя (*Puccinia*
graminis), желтая ржавчина ячменя (*Puccinia striiformis*), полосатость листьев ячменя
(*Pyrenophora graminea*), бактериальный ожог листьев ячменя (*Rhynchosporium secalis*), пыльная
головня ячменя (*Ustilago nuda*), сетчатая пятнистость ячменя (*Pyrenophora teres*), *Fusarium*
красная фузариозная гниль ячменя (*Fusarium graminearum*, *Microdochium nivale*), настоящая
25 мучнистая роса пшеницы (*Erysiphe graminis f. sp. tritici*), ржавчина листьев пшеницы (*Puccinia*
recondita), желтая ржавчина пшеницы (*Puccinia striiformis*), глазковая пятнистость пшеницы
(*Pseudocercospora herpotrichoides*), красная фузариозная гниль пшеницы (*Fusarium*
graminearum, *Microdochium nivale*), септориоз колосковой чешуи пшеницы (*Phaeosphaeria*
nodorum), септориоз листьев пшеницы (*Zymoseptoria tritici*), фузариозная снежная плесень
30 пшеницы (*Microdochium nivale*), выпревание пшеницы (*Gaeumannomyces graminis*),
пятнистость оболочки зерна пшеницы (*Epicoccum spp.*), желтая пятнистость листьев пшеницы
(*Pyrenophora tritici-repentis*), снежная плесень пшеницы (*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*),
долларовая пятнистость трав (*Sclerotinia homoeocarpa*), бурая пятнистость трав (*Rhizoctonia*
solani), бурая пятнистость (*Rhizoctonia solani*), антракноз трав (*Collectotrichum graminicola*),
35 серая пятнистость листьев травы (*Pyricularia grisea*), некротическая кольцевая пятнистость
травы (*Ophiosphaerella koenrae*), красная нитчатость травы (*Laetisaria fuciformis*), ржавчина травы
(*Puccinia zoysiae*), офиболез травы (*Magnaporthe poae*), выпревающая корневая гниль травы
(*Gaeumannomyces graminis*), бурая кольцевая пятнистость (*Waitea circinata*), заболевание

травы «ведьмины кольца» (*Agaricus*, *Calvatia*, *Chlorophyllum*, *Clitocybe*, *Lepiota*, *Lepista*, *Lycoperdon*, *Marasmius*, *Scleroderma*, *Tricholoma*, и т. п.), фузариозная снежная плесень травы (*Microdochium nivale*), серый тифулез травы (*Typhula incarnate*, *Typhula incarnation*), пятнистость листьев травы (*Curvularia* sp.), пятнистость *Rhizoctonia* (*Ceratobasidium* sp.),
5 увядание цойсии (*Gaeumannomyces* sp., *Phialophora* sp.), пузырчатая головня кукурузы (*Ustilago maydis*), антракноз кукурузы (*Colletotrichum graminicola*), глазковая пятнистость кукурузы (*Kabatiella zeae*), серая пятнистость листьев кукурузы (*Cercospora zeae-maydis*), гельминтоспориоз листьев кукурузы (*Setosphaeria turcica*), фитофтороз листьев кукурузы (*Cochliobolus carbonum*), бурая пятнистость кукурузы (*Physoderma maydis*), ржавчина кукурузы
10 (*Puccinia* spp.), глазковая пятнистость листьев кукурузы (*Bipolaris maydis*), желтая пятнистость листьев кукурузы (*Phyllosticta maydis*), стеблевая гниль кукурузы (*Gibberella zeae*), ржавчина сахарного тростника (*Puccinia* spp.), настоящая мучнистая роса тыквенных (*Sphaerotheca fuliginea*), антракноз тыквенных (*Colletotrichum lagenarium*, *Glomerella cingulata*), ложная мучнистая роса огурцов (*Pseudoperonospora cubensis*), черная ножка огурцов (*Phytophthora capsici*), увядание огурцов (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cucumerinum*), увядание арбузов (*Fusarium oxysporum* f. sp. *niveum*), настоящая мучнистая роса яблок (*Podosphaera leucotricha*), черная парша яблок (*Venturia inaequalis*), пятнистость яблоневого цвета (*Monilinia mali*), альтернариозная пятнистость яблок (*Alternaria alternata* apple pathotype), гниль яблок (*Valsa mali*), черная парша груш (*Alternaria alternata* pear pathotype), настоящая мучнистая роса груш
20 (*Phyllactinia pyri*), ржавчина груш (*Gymnosporangium asiaticum*), парша груш (*Venturia nashicola*), настоящая мучнистая роса клубники (*Sphaerotheca humuli*), бурая гниль косточковых (*Monilinia fructicola*), голубая плесень цитрусовых (*Penicillium italicum*), настоящая мучнистая роса винограда (*Uncinula necator*), ложная мучнистая роса винограда (*Plasmopara viticola*), гломереллезная гниль ягод винограда (*Glomerella cingulata*), ржавчина винограда (*Phakopsora ampelopsidis*), черная сигатока банана (*Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella musicola*), настоящая мучнистая роса томатов (*Erysiphe cichoracearum*), альтернариоз томатов (*Alternaria solani*), настоящая мучнистая роса баклажанов (*Erysiphe cichoracearum*), альтернариоз картофеля (*Alternaria solani*), антракноз картофеля (*Potatotrichum coccodes*), настоящая мучнистая роса картофеля (*Erysiphe* spp, *Leveillula taurica*), бурая фитофторозная гниль картофеля (*Phytophthora infestans*), настоящая мучнистая роса табака (*Erysiphe cichoracearum*), бурая пятнистость табака
30 (*Alternaria longipes*), листовая пятнистость свеклы (*Cercospora beticola*), настоящая мучнистая роса сахарной свеклы (*Erysiphe betae*), корневая гниль сахарной свеклы (*Thanatephorus cucumeris*), пятнистость листьев свеклы (*Cercospora beticola*), настоящая мучнистая роса сахарной свеклы (*Erysiphe betae*), пятнистость листьев сахарной свеклы (*Thanatephorus cucumeris*), корневая гниль сахарной свеклы (*Thanatephorus cucumeris*), черная корневая гниль сахарной свеклы (*Aphanomyces cochlioides*), увядание редиса (*Fusarium oxysporum* f. sp. *raphani*), антракноз чая (*Discula theae-sinensis*), пузырьковая пятнистость чая (*Exobasidium vexans*), бурая глазчатая пятнистость чая (*Pseudocercospora ocellata*, *Cercospora chaae*),

альтернариоз чая (*Pestalotiopsis longiseta*, *Pestalotiopsis theae*), маслянистая пятнистость чая (*Exobasidium reticulatum*), альтернариоз хлопка (*Alternaria* spp.), антракноз хлопка (*Glomerella* spp.), аскохитоз хлопка (*Ascochyta gossypii*), ржавчина хлопка (*Puccinia* spp, *Phytophthora* spp), пятнистость листьев хлопка (*Cercospora* spp.), антракноз хлопка (*Diploria* spp), пятнистость 5 хлопка (*Phoma* spp), пятнистость листьев хлопка (*Stemphyllium* spp), поздняя пятнистость листьев арахиса (*Cercosporidium personatum*), бурая пятнистость листьев арахиса (*Cercospora arachidicola*), южная склероциальная гниль арахиса (*Sclerotium rolfsii*), ржавчина арахиса (*Puccinia arachidis*), желтая сигатока банана (*Mycosphaerella musicola*), черная сигатока банана (*Mycosphaerella fijiensis*), серая плесень, поражающая различные сельскохозяйственные 10 культуры (*Botrytis cinerea*), заболевания *Pythium* (*Pythium* spp) и заболевания *Pythium* (*Sclerotinia sclerotiorum*). Примеры также включают заболевания на семенах или заболевания раннего роста различных растений, вызванные родом *Aspergillus*, родом *Cochliobolus*, родом *Corticium*, родом *Diplodia*, родом *Penicillium*, родом *Fusarium*, родом *Gibberella*, род *Mucor*, род *Phoma*, род *Phomopsis*, род *Pyrenophora*, род *Pythium*, род *Rhizoctonia*, род *Rhizopus*, род 15 *Typhlodendria*, род *Tilletia*, род *Trichoderma* и род *Ustilago*.

[0100] Среди вышеупомянутых заболеваний сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему варианту осуществления демонстрирует особенно превосходные 20 эффекты борьбы с ржавчиной листьев семейства пшеницы, такой как ожог листьев пшеницы и ржавчина листьев ячменя. Соответственно, сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид преимущественно применяют для борьбы с пшеницей, без ограничения таким применением.

[0101] Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему варианту 25 осуществления можно применять для всех растений, и примеры применимых растений включают следующие. Роасеае, например рис, пшеница, ячмень, рожь, овес, тритикале, кукуруза, сорго, сахарный тростник, травы, полевица, бермудская трава, овсяница и плевел; бобовые, например соя, арахис, фасоль, горох, фасоль лучистая и люцерна; семейство *Convolvulaceae*, например сладкий картофель; семейство *Solanaceae*, например перец 30 стручковый, перец сладкий, томат, баклажан, картофель и табак; семейство *Polygonaceae*, например гречиха; семейство *Asteraceae*, например подсолнечник; семейство *Araliaceae*, например женьшень; семейство *Brassicaceae*, например рапс, китайская капуста, репа, капуста и дайкон; семейство *Chenopodiaceae*, например сахарная свекла; семейство *Malvaceae*, например хлопок; семейство *Rubiaceae*, например кофейное дерево; семейство *Sterculiaceae*, например 35 какао; семейство *Theaceae*, например чайный лист; семейство *Cucurbitaceae*, например арбуз, дыня, огурец и тыква; семейство *Liliaceae*, например лук, лук-порей и чеснок; семейство *Rosaceae*, например земляника, яблоня, миндаль, абрикос, слива, желтый персик, японская слива, персик и груша; семейство *Ariaceae*, например морковь; семейство *Agaceae*, например

таро; семейство Larvae, например манго; семейство Bromeliaceae, например ананас; семейство Caricaceae, например папайя; семейство Ebenaceae, например хурма; семейство Ericaceae, например черника; семейство Juglandaceae, например pekan; семейство Musaceae, например банан; семейство Oleaceae, например олива; семейство Palmae, например кокос и финиковая пальма; семейство Rutaceae, например мандарин, апельсин, грейпфрут и лимон; семейство Vitaceae, например виноград; цветы и декоративные растения; деревья, отличные от фруктовых деревьев и иных декоративных растений. Другие примеры включают дикие растения, культурные растения, растения и сорта растений, полученные путем известного биологического разведения, такого как гибридизация или плазмогалия, и генетически рекомбинантные сорта растений, полученные посредством геной инженерии, которые были одобрены в различных странах. Примеры таких генетически рекомбинантных культурных культур включают культуры, собранные в базе данных Международной службы по сбору сведений о применении биотехнологий в сельском хозяйстве (ISAAA). Конкретные примеры включают в себя такие, как Roundup Ready, Liberty Link, IMI, SCS, Cleafield, Enlist, B.t., BXN, Poast Compatible, AgriSure, Genuity, Optimum, Powercore, DroughtGard, YieldGard, Herculex, WideStrike, Twinlink, VipCot, GlyTol, Newleap, KnockOut, BiteGard, BtXtra, StarLink, Nucotn, NatureGard, Protecta, SmartStax, Power Core, InVigor и Bollgard.

[0102] (2) Состав

Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему варианту осуществления может включать производное азота (I) и другой активный ингредиент. Таким образом, примеры фунгицида включают в себя следующие: (a) состав, содержащий производное (I) азота и другой активный ингредиент; и (b) комбинацию первого препарата, содержащего производное (I) азота, и второго препарата, содержащего другой активный ингредиент, которые смешивают непосредственно перед применением. Далее в настоящем документе форма (a) называется «составленным сельскохозяйственным или садоводческим фунгицидом», а форма (b) называется «смешанным в баке сельскохозяйственным или садоводческим фунгицидом».

[0103] (2-1) Составленный сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид

Содержание производного азота (I) в составленном сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде составляет, например, от 0,1 до 95 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 90 мас.% и более предпочтительно от 2 до 80 мас.%. Содержание производного (I) азота в распыленной жидкости во время фактического распыления не имеет конкретных ограничений при условии, что оно может проявлять необходимую активность.

[0104] Производное (I) азота, включенное в качестве активного ингредиента в состав сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, может представлять собой одно соединение или смесь двух или более видов соединений.

5 [0105] Содержание другого активного ингредиента в составленном сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде составляет, например, от 0,1 до 95 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 90 мас.% и более предпочтительно от 2 до 80 мас.%. Содержание другого активного ингредиента в распыляемой жидкости во время фактического распыления не имеет конкретных ограничений при условии, что он может проявлять необходимую активность. Составленный
10 сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид включает производное азота (I) и другой активный ингредиент и может дополнительно включать твердый носитель, жидкий носитель (разбавитель), поверхностно-активное вещество или другое вспомогательное вещество, описанное ниже.

15 [0106] (2-2) Смешанный в баке сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид

Содержание производного азота (I) и другого активного ингредиента в смешанном в баке сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде может быть таким же, как и соответствующее содержание в вышеупомянутом составленном сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде. Первый препарат, включающий производное (I) азота для
20 получения смешанного в баке сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, может находиться в той же форме, что и составленный сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид, за исключением того, что он не содержит других активных ингредиентов. Второй препарат, содержащий другой активный ингредиент, который применяют для получения смешанного в баке сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, может быть в той же
25 форме, что и составленный сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид, за исключением того, что он не содержит производного азота (I). Содержание производного (I) азота в первом препарате и содержание другого активного ингредиента во втором препарате должны быть такими, чтобы можно было достичь содержания производного (I) азота и
30 содержания другого активного ингредиента в готовом смешанном в баке сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде.

[0107] Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид включает производное азота (I) и другой активный ингредиент и может дополнительно включать твердый носитель, жидкий
35 носитель (разбавитель), поверхностно-активное вещество или другое вспомогательное вещество, описанное ниже.

[0108] Соотношение смешивания первого препарата и второго препарата в смешанном в баке сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде может быть определено в соответствии с композицией и назначением каждого препарата.

5 [0109] В смешанном в баке сельскохозяйственном или садоводческом химическом средстве первый препарат, содержащий производное азола (I), и второй препарат, содержащий другой активный ингредиент, готовят отдельно и смешивают вместе для получения сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида. Таким образом, объем настоящего изобретения также включает в себя продукт для борьбы с болезнями растений, который
10 представляет собой комбинированный препарат, отдельно включающий в себя производное азола (I) и другой активный ингредиент, которые смешивают перед применением для борьбы с болезнями растений.

[0110] (2–3) Вспомогательное средство для составления

15

Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид получают путем смешивания производного азола (I) и другого активного ингредиента с твердым или жидким носителем (разбавителем), поверхностно-активным веществом и другим вспомогательным средством для
20 составления, а затем получают в различных формах, таких как порошки, смачиваемые порошки, гранулы и эмульсии. Фунгицид может дополнительно включать известные биологические поверхностно-активные вещества в качестве адъювантов, такие как липиды маннозилальдитола, софоролипиды, рамнолипиды, липиды трегалозы, липиды целлобиозы, липиды глюкозы, сложные эфиры жирных кислот олигосахаридов, поверхностно-активное вещество, сераэтин, лицензин и арсрофатин.

25

[0111] Ниже приведены примеры твердого носителя, жидкого носителя и поверхностно-активного вещества, применяемых в качестве вспомогательных средств для составления. Во-первых, примеры твердого носителя включают порошковые носители и гранулированные носители, такие как минералы, такие как глина, тальк, диатомовая земля, цеолит, монтмориллонит, бентонит, кислотная глина, активированная глина, аттапульгит, кальцит, вермикулит, перлит, пемза, и кварцевый песок; синтетические органические материалы, такие как мочевины; соли, такие как карбонат кальция, карбонат натрия, сульфат натрия, гашеная
30 известь и пищевая сода; синтетические неорганические материалы, такие как аморфный диоксид кремния, такой как белый углерод и диоксид титана; растительные носители, такие как
35 древесная мука, стебли кукурузы (початки), скорлупа грецкого ореха (ореховая скорлупа), фруктовое ядро, обсевки, опилки, отруби, соевая мука, порошковая целлюлоза, крахмал, декстрин и сахара; а также различные полимерные носители, такие как поперечно-сшитый лигнин, катионный гель, желатин, гелеобразующий при нагревании или соль поливалентного

металла, водорастворимый полимерный гель, такой как агар, хлорированный полиэтилен, хлорированный полипропилен, поливинилацетат, поливинилхлорид, сополимер этилена и винилацетата и мочевино-альдегидная смола.

5 [0112] Примеры жидкого носителя включают алифатические растворители (парафины), ароматические растворители (например, ксилол, алкилбензол, алкилнафталин и сольвент-нафта), смешанные растворители (керосин), машинные масла (рафинированные высококипящие алифатические углеводороды), спирты (например, метанол, этанол, изопропанол, и циклогексанол), многоатомные спирты (например, этиленгликоль, 10 диэтиленгликоль, пропиленгликоль, гексиленгликоль, полиэтиленгликоль и полипропиленгликоль), производные многоатомного спирта (например, простой эфир пропиленгликоля), кетоны (например, ацетон, ацетофенон, циклогексанон, метилциклогексанон, и γ -бутиролактон), сложные эфиры (метиловый эфир жирных кислот (метиловый эфир жирных кислот кокосового масла), этилгексиллактат, пропиленкарбонат, 15 метиловый эфир двухосновной кислоты (диметиловый эфир янтарной кислоты, диметиловый эфир глутаминовой кислоты и диметиловый эфир адипиновой кислоты)), азотсодержащие носители (N-алкилпирролидоны), масла и жиры (например, кокосовое масло, соевое масло и рапсовое масло), амидные растворители [диметилформамид, (N,N-диметил)октанамид, N,N-диметилдеканамид, метиловый эфир 5-(диметиламино)-2-метил-5-оксо-валериановой кислоты, 20 растворители на основе N-ацилморфолина (например, № CAS 887947-29-7)], диметилсульфоксид, ацетонитрил и вода.

[0113] Примеры неионогенных поверхностно-активных веществ могут относиться, например, сложный эфир сорбитана и жирных кислот, сложный эфир полиоксиэтилена-сорбитана и жирных кислот, сложный эфир сахарозы и жирных кислот, сложный эфир полиоксиэтилена и жирных кислот, сложный эфир полиоксиэтилена и смоляных кислот, сложный диэфир полиоксиэтилена и жирных кислот, простой алкиловый эфир полиоксиэтилена, простой фенилалкиловый эфир полиоксиэтилена, простой диалкилфениловый эфир полиоксиэтилена, конденсат полиоксиэтилен-алкилфенилового эфира 30 и формалина, блок-полимер полиоксиэтилен/полиоксипропилен, алкиэфирный блок-полимер полиоксиэтилен/полиоксипропилен, полиоксиэтиленалкиламин, амид полиоксиэтилена и жирной кислоты, простой жирнокислотнo-бисфениловый эфир полиоксиэтилена, простой бензилфениловый (или фенилфениловый) эфир полиоксиэтилена, простой стирилфениловый (или фенилфениловый) эфир полиоксиэтилена, полиоксиэтиленовый простой эфир и 35 поверхностно-активные вещества на основе сложноэфирного силикона и фтора, полиоксиэтилен-касторовое масло, полиоксиэтилен-гидрогенизированное касторовое масло и алкилгликозиды. Примеры анионных поверхностно-активных веществ включают сульфатные соли, например сульфат алкила, сульфат полиоксиэтилен-алкилового эфира, сульфат

полиоксиэтилен-алкилфенилового эфира, сульфат полиоксиэтилен-бензил (или стирил) фенил (или фенилфенил) эфира, полиоксиэтилен, сульфат полиоксипропилен-блокполимера; сульфонатные соли, например сульфонат парафина (алкан), сульфонат α -олефина, сульфосукцинат диалкила, сульфонат алкилбензола, сульфонат моно или диалкилнафтадена, конденсат сульфоната нафтадена с формалином, дисульфонат алкилдифенилэфира, сульфонат лигнина, сульфонат полиоксиэтиленалкилфенилэфира и полуэфир полиоксиэтиленалкилэфирсульфоянтарной кислоты; соли жирных кислот, например саркозинат жирной кислоты, N-метилжирной кислоты и смоляная кислота; фосфатные соли, например фосфат полиоксиэтиленалкилэфира, фосфат полиоксиэтиленмоно или диалкилфенилэфира, фосфат полиоксиэтилен бензил (или стирил) фенил (или фенилфенил)эфир, блок-полимер полиоксиэтилена /полиоксипропилена, фосфатидилэтаноламин фосфатидилхолина (лецитин) и алкилфосфаты. Примеры катионных поверхностно-активных веществ включают соли аммония, такие как хлорид алкилтриметиламмония, хлорид метилполиоксиэтиленалкиламмония, бромид алкил-N-метилпиридиния, хлорид моно-или диалкилметилированного аммония, алкилпентаметилпропилендиамина дихлорид; и соли бензалкония, такие как хлорид алкилдиметилбензалкония и хлорид бензетония (хлорид октилфеноксисэтоксиэтилдиметилбензиламмония).

[0114] Примеры других вспомогательных средств для составления включают неорганические соли, применяемые в качестве регуляторов pH, таких как натрий и калий; пеногасители на основе фтора и кремния; водорастворимые соли, такие как обычная соль; водорастворимые полимеры, применяемые в качестве загустителей, таких как ксантановая камедь, гуаровая камедь, карбоксиметилцеллюлоза, поливинилпирролидон, карбоксивиниловый полимер, акриловый полимер, поливиниловый спирт, производные крахмала и полисахариды; альгиновую кислоту и ее соли; стеараты металлов, триполифосфат натрия, гексаметафосфат натрия, применяемый в качестве разлагающих диспергирующих средств; антисептики; красители; антиоксиданты; УФ-поглощители; а также средства для снижения химического повреждения.

[0115] Некоторые составы применяют как есть, а некоторые из них перед применением разбавляют разбавителем, таким как вода, до заданной концентрации. При разбавлении до применения общая концентрация всех активных ингредиентов, включая производное азола (I) и другой активный ингредиент, предпочтительно составляет от 0,001% до 1,0%.

[0116] Общее количество активных ингредиентов, включая производное (I) азола и другие активные ингредиенты, составляет от 20 до 5000 г, более предпочтительно от 50 до 2000 г на гектар сельскохозяйственной или садоводческой области, такой как поля, рисовые плантации, плодовые сады и теплицы. Данные концентрации и количества могут быть увеличены или

уменьшены без учета вышеуказанных диапазонов, поскольку они зависят от состава, времени применения, способа применения, местоположения применения и целевых культур.

[0117] [5. Способ борьбы с болезнями растений]

5

Сельскохозяйственные или садоводческие фунгициды по настоящему варианту осуществления можно применять в сельскохозяйственных или несельскохозяйственных областях, таких как поля, рисовые плантации, газоны и плодовые сады. Кроме того, сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему варианту осуществления может быть применен не только посредством обработки листьев, такой как распыление листьев, но также посредством обработки, отличной от обработки листьев, такой как обработка семян, включая обработку луковиц и клубней, обработку системы полива почвы и обработку поверхности воды. Таким образом, способ борьбы с болезнями растений по настоящему варианту осуществления представляет собой способ, включающий этап проведения обработки листвы или других способов обработки с использованием сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, описанного выше. При проведении других способов обработки количество необходимого труда можно уменьшить по сравнению со способом, когда выполняется обработка листвы.

[0118] При обработке семян химическое вещество наносят на семена путем смешивания и перемешивания смачиваемого порошка и порошка с семенами или путем погружения семян в разбавленный смачиваемый порошок. Обработка семян также включает обработку семян посредством нанесения покрытия. Общее количество активных ингредиентов, включая производное (I) азола и другие активные ингредиенты при обработке семян, составляет, например, от 0,01 до 10 000 г, предпочтительно от 0,1 до 1000 г на 100 кг семян. Семена, обработанные сельскохозяйственным или садоводческим фунгицидом, можно использовать таким же образом, как и обычные семена.

[0119] Нанесение посредством системы полива почвы осуществляют путем обработки посадочной лунки или окружающей ее области гранулами и т. п. во время трансплантации рассады или путем обработки почвы вокруг семян или растительного организма, например, гранулами или смачиваемым порошком. Общее количество активных ингредиентов, используемых в случае обработки посредством системы полива почвы, составляет, например, от 0,01 до 10 000 г, предпочтительно от 0,1 до 1000 г на 1 м² сельскохозяйственного или садового участка.

35

[0120] В случае применения при обработке поверхности воды поверхность воды рисового поля можно обрабатывать гранулами или т. п. Общее количество активных ингредиентов,

используемых в случае обработки поверхности воды, составляет, например, от 0,1 до 10 000 г, предпочтительно от 1 до 1000 г на 10 акров рисовой плантации.

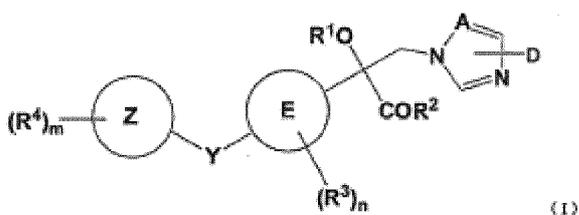
[0121] Общее количество активных ингредиентов, используемых для опрыскивания листвы, составляет, например, от 20 до 5000 г, предпочтительно от 50 до 2000 г на 1 га сельскохозяйственного или садового участка, например поля, рисовой плантации, плодового сада или теплицы.

[0122] Концентрация и количество используемых активных ингредиентов могут быть увеличены или уменьшены без учета вышеуказанного диапазона, поскольку они зависят от состава, времени применения, способа применения, местоположения применения и целевых культур.

[0123] [Краткое описание]

15 Как было описано выше, сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по настоящему изобретению включает производное азота, представленное следующей общей формулой (I), в качестве одного из активных ингредиентов, и дополнительно включает другой активный ингредиент.

[0124] [Химическая формула 9]



25 где

A представляет собой N или CH;

D представляет собой водород, галогеновую группу или SR^D, при этом R^D представляет собой водород, цианогруппу, C₁-C₆-алкильную группу, C₁-C₆-галогеналкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-галогеналкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу или C₂-C₆-галогеналкинильную группу.

R¹ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу, фенил-C₂-C₄-алкинильную группу или COXR⁵;

5

причем R⁵ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу или фенил-C₂-C₄-алкинильную группу;

10

X представляет собой одинарную связь, -O- или -NR⁶-;

R⁶ представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу или фенил-C₂-C₄-алкинильную группу; а R⁵ и R⁶ могут образовывать кольцо;

15

R² представляет собой -OR⁷ или -NR⁸R⁹;

каждый из R⁷, R⁸ и R⁹ независимо представляет собой водород, C₁-C₆-алкильную группу, C₂-C₆-алкенильную группу, C₂-C₆-алкинильную группу, C₃-C₈-циклоалкильную группу, C₃-C₈-циклоалкил-C₁-C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁-C₄-алкильную группу, фенил-C₂-C₄-алкенильную группу или фенил-C₂-C₄-алкинильную группу, при этом R⁸ и R⁹ могут образовывать кольцо,

20

25

Алифатические группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ может иметь 1, 2, 3 или возможное максимальное число одинаковых или разных групп R^a, при этом R^a независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, C₁-C₄-алкоксигруппы и C₁-C₄-галогеналкоксигруппы.

30

R⁴ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, аминогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, C₁-C₄-алкильную группу, C₁-C₄-галогеналкильную группу, C₁-C₄-алкоксигруппу или C₁-C₄-галогеналкоксигруппу, C₁-C₄-алкиламиногруппу, C₁-C₄-диалкиламиногруппу, C₁-C₄-алкилациламиногруппу, -SOR¹⁰ или -SF₅;

35

циклоалкиламиногруппа или фенильный фрагмент в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ или фенильный фрагмент в R⁴ могут иметь 1, 2, 3, 4, 5 или возможное максимальное количество одинаковых или разных групп R^b, при этом R^b независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы,

нитрогруппы, C₁–C₄-алкильной группы, C₁–C₄-алкоксигруппы, C₁–C₄-галогеналкильной группы и C₁–C₄-галогеналкоксигруппы;

5 R³ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, C₁–C₄-алкильную группу, C₁–C₄-галогеналкильную группу, C₁–C₄-алкоксигруппу, C₁–C₄-галогеналкоксигруппу, –SOR¹⁰ или –SF₅;

R¹⁰ представляет собой C₁–C₄-алкильную группу или C₁–C₄-галогеналкильную группу.

10 E представляет собой фенильную группу или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N;

n R³ связаны с любыми положениями замещения;

15 если E представляет собой фенильную группу, то n равно 0, 1, 2, 3 или 4, и если E представляет собой 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N, то n представляет собой 0, 1 или 2;

20 Y представляет собой атом кислорода, –CH₂O–, –OCH₂–, –NH–, –N(C₁–C₄-алкил)–, –N(C₃–C₆-циклоалкил)– или –S(O)_p–, который связан с любыми положениями на E;

p равно 0, 1 или 2;

25 Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, которая представляет собой фенильную или нафтильную группу, 5- или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, или 9- или 10-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, состоящее из двух колец;

m R⁴ связаны с любым положением замещения;

30

если Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, то m равно 1, 2, 3, 4 или 5, а если Z представляет собой ароматическое гетероциклическое кольцо, то m равно 0, 1, 2, 3 или 4.

35 Кроме того, в сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению другой активный ингредиент предпочтительно включает по меньшей мере один, выбранный из (i) фунгицида, выбранного из ингибиторов синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот, ингибиторов митотического разделения/клеточного разделения, ингибиторов дыхания, ингибитора биосинтеза аминокислот/белков, ингибиторов передачи сигнала, ингибитора

биосинтеза липидов или транспортировки/структуры клеточной мембраны или функции, ингибиторов биосинтеза стерола клеточной мембраны, ингибиторов биосинтеза клеточной стенки, ингибиторов биосинтеза меланина, индукторов устойчивости растения-хозяина и многоцентровые фунгициды;

5

(ii) инсектицида, выбранного из модуляторов никотиновых ацетилхолиновых рецепторов, модуляторов натриевых каналов, модуляторов рецепторов рианодина, ингибиторов ацетилхолинэстеразы, разобщающих средств окислительного фосфорилирования и ингибиторов комплекса I митохондриальной цепи переноса электронов; и

10

(iii) регуляторов роста растений.

[0125] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из беналаксила, беналаксила-М, фуралаксила, офурацила, бупиримата, диметиримола, этиримола, октилинона, металаксила, металаксила-М, оксадиаксила и гимексазола.

15

[0126] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор митотического деления/движущего белка предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из беномила, карбендазима, фуберидазола, тиабендазола, тиофаната, тиофанат-метила, диэтофенкарба, зоксамида, этабоксама, пенцикурона, флупиколида, фенамакрила, метрафенона и пириофенона.

20

[0127] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор дыхания предпочтительно выбран из толфенпирада, дифлуметорима, феназахина, пидифлуметофена, фенофурама, карбоксина, оксикарбоксина, беноданила, флутоланила, мепронила, изофетамида, бензовиндифлупира, бикафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, инпирфлуксама, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, седаксана, изофлуципрама, боскалида, флуопирама, тифлузамида, пиразифлумида, пирибенкарба, флуоксастробина, фенамидона, мандестробина, азоксистробина, кумоксистробина, энноксастробина, флуфеноксистробина, пикоксистробина, пираоксистробина, триклопирикарба, фенаминстробина, метминостробина, оризастробина, крезоксимметила, трифлуксистробина, циазофамида, амисульброма, фенпикоксамида, флорилпикоксамида, бинапакрила, мептилдинокапа, динокапа, флуазинама, ацетата трифенилового, хлорида трифенилового, гидроксида трифенилового, силтиофама, аметоктрадина, метилтетрапрола, пирпропоина и инпирфлуксама.

25

30

35

[0128] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор биосинтеза аминокислот/белков предпочтительно включает по меньшей мере один из ципродинила, мепанипирима, пириметанила, бластицидина, касугамицина, стрептомицина и окситетрациклина.

5

[0129] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор передачи сигнала предпочтительно включает по меньшей мере один, выбранный из хиноксифена, проквиназида, хлозолината, диметаклора, фенпиклонила, флудиоксонила, ипродиона, процимидона и винклозолина.

10

[0130] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор биосинтеза липидов или транспорта/структуры или функции клеточной мембраны предпочтительно представляет собой по меньшей мере один ингибитор, выбранный из изопропиолана, эдифенфоса, ипробенфоса (IBP), пиразофоса, бифенила, хлоронеба, дихлорана, хинтозена (PCNB), текназена (TCNB), толклофосметила, этридиазола, протиокарба, пропамокарба, натамицина, оксатиапипролина и флуоксапипролина.

15

[0131] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор биосинтеза стерола клеточной мембраны предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из имазалила, окспоконазола, пефуразоата, прохлораза, трифлумизола, трифорина, пирифенокса, пиризоксазола, фенаримола, нуаримола, азаконазола, битертанола, бромуконазола, ципроконазола, дифенокконазола, диниконазола эпоксиконазола, этаконазола, фенбуконазола, флухинконазола, флусилазола, флутриафола, гексаконазола, имибенконазола, метконазола, ипконазола, миклобутанила, пенконазола, пропиконазола, симеконазола, тебуконазола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, мефентрифлуконазола, протиоконазола, тридеморфа, фенпропиморфа, фенпропидина, пипералина, спироксамина, фенпиразамина, фенгексамида, нафтифина, тербинафина, пирибутикарба и ипфентрифлуконазола.

20

25

[0132] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор биосинтеза клеточной стенки предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из полиоксина, диметоморфа, флуморфа, пириморфа, мандипропамида, бентиаваликарба, ипроваликарба и валифеналата.

30

[0133] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор биосинтеза меланина предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из фталида, трициклазола, пирокирона, карпропамида, диклоцита, феноксанила и толпрокарба.

35

[0134] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению индуктор устойчивости растения-хозяина предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из ацибензолар-S-метила, пробеназола, тиадинила, ламинарина, изотианила, ламинарина, фосетила-Al, фосфорной кислоты и фосфонатов.

[0135] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению многоцентровый фунгицид предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из цимоксанила, теклофалама, триазоксида, флусульфамида, дикломезина, цифлуфенамида, ддина, флутанила, феримзона, тебуфлохина, пикарбутразокса, валидамицина, минерального масла, пищевой соды, карбоната калия, соединений меди и меди, серы, фербама, манкоцеба, манеба, метрима, пропинеба, тирама, цирама, каптана, каптафола, фолпетта, хлорталонила (TPN), гуазатина, иминоктадина ацетата, иминоктадина альбезилата, анилазина, дитианона, фторимида, метасульфокарба, флорилпикоксамида, флуопимомида, ипфлуфенохина, хинометионата, пиридахлометила, аминопирифена, дихлобентиазокса, хинофумелина и дипиметитрона.

[0136] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению модулятор, являющийся антагонистом никотинового ацetylхолинового рецептора, предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из ацетамиприда, клотианидина, динотефурана, имидаклоприда, нитифенпирама, тиаклоприда, тиаметоксама, сульфоксахлора, флупирадифурона и трифлумезопира.

[0137] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению модулятор натриевого канала предпочтительно представляет собой по меньшей мере одно пиретроидное соединение, выбранное из акринатрина, аллтрина, ципертрина, бифентрина, циклопротрина, цигалотрина, ципертрина, дельтаметрина, димефлутрина, эсфенвалерата, этофенпрокса, фенпропарина, фенвалерата, флубромцитрината, флуцитрината, флувалината, галофенпрокса, цигалотрина, метофлутрина, момфтортрина, перметрина, профлутрина, тефлутрина, тралометрина, цифлутрина, бифентрина, имипротрина, пиретрина, цифенотина, хлорпралтрина, эпсилон-метофлутрина и эпсилон-мофтортрина.

[0138] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению модулятор рецептора рианоидина предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из хлорантранилипрола, циантранилипрола, флубендиамида и цигалодиамида.

[0139] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению ингибитор ацetylхолинэстеразы предпочтительно представляет собой по меньшей мере один,

выбранный из ацефата, азинафос-метила, кадзафоса, хлоретоксифоса, хлорфенвинфоса, хлорпирифоса, цианофоса, деметон-S-метила, диазинона, дихлорфоса (DDVP), дикротофоса, диметоата, дисульфотона, этиона, этопрофоса, EPN, фенамифоса, фенитротиона (MEP), фентиона (MPP), фостиазата, имициафоса, изофенфоса, изоксатиона, малатиона, 5 метамидофоса, метидатиона, мевинфоса, монокротофоса, ометоата, оксидеметон-метила, паратиона, паратион-метила, фентоата, фората, фосалона, фосмета, фосфамидона, оксима, пиримифос-метила, профенофоса, протиофоса, пиралофоса, пиридафентиона, хиналфоса, тебупиримфоса, тербуфоса, триазофоса, трихлорфона (DEP), аланикарба, алдикарба, бенфуракарба, ВРМС, карбарила (NAC), карбофурана, карбосульфана, картапа, феноксикарба 10 (ВРМС), форметаната, изопрокарба (MIPC), метиокарба, метомила, оксамилла, пиримикарба, тиодикарба, ХМС, бендиокарба, этиофенкарба, фенобукарба, фенотиокарба, фуратиокарба, метолкарба и ксиллилкарба.

[0140] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению 15 разобщающее средство окислительного фосфорилирования предпочтительно представляет собой по меньшей мере один из хлорфенапира, DNOC и сульфлурамида.

[0141] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению 20 ингибитор комплекса митохондриальной цепи переноса электронов I предпочтительно представляет собой один, выбранный из тебуфенпирада, толфенпирада, феназахина, фенпироксимата, пиридабена, пиримидифена и ротенона.

[0142] В сельскохозяйственном или садоводческом фунгициде по настоящему изобретению 25 регулятор роста растений предпочтительно представляет собой по меньшей мере один, выбранный из аминоксавинилглицина, хлормеквата, хлорпрофама, цикланилида, дикеглака, даминозида, этефона, флурпримидола, флуметралина, форхлорфенурана, гибберелина, гидразида малеата, мепиквата хлорида, метилциклопропена, бензиламинопурина, паклобутразола, прогексадиона, тидиазурана, трибутилфосфоротритиоата, тринексапак-этила и 30 униказола.

[0143] Способ борьбы с болезнями растений по настоящему изобретению включает в себя 35 стадию проведения обработки листы или других способов обработки с использованием сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида, описанного выше.

[0144] Продукт для борьбы с болезнями растений по настоящему изобретению предназначен 40 для получения вышеупомянутого сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида и включает в себя производное азота и другой активный ингредиент, перечисленные выше по

отдельности, в качестве комбинированного препарата, подлежащего смешиванию перед применением.

5 [0145] Ниже приведены примеры для более подробного описания вариантов осуществления настоящего изобретения. Настоящее изобретение, разумеется, не ограничено приведенными ниже примерами, и само собой разумеется, что возможны различные аспекты для 10 подробностей. Более того, настоящее изобретение не ограничивается описанными выше вариантами осуществления, и возможны различные модификации в пределах объема, указанного в формуле изобретения. Варианты осуществления, полученные соответствующей комбинацией технических средств, описанных в вариантах осуществления, также включены в 15 технический объем настоящего изобретения. Кроме того, все документы, описанные в настоящей спецификации, включены в нее посредством ссылки.

ПРИМЕРЫ

15

[0146] <Пример синтеза 1 Синтез производного азола I-1>

Синтез 2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)-2-оксоуксусной кислоты

20 Добавляли 761 мг доступного в продаже 1-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)-этан-1-она и 10,8 мл DMSO и растворяли в круглодонной колбе на 100 мл, добавляли 2,21 г йода, повышали температуру до 100°C и перемешивали смесь. Через 3 часа после начала реакции добавляли насыщенный водный раствор сульфита натрия для остановки реакции и смесь экстрагировали 25 толуолом 3 раза. Экстракт промывали 3 раза водой и один раз насыщенным соевым раствором. После сушки над безводным сульфатом натрия растворитель отгоняли с получением 181 мг неочищенной оранжевой жидкости, но необходимый продукт в ней не содержался. Водный 30 слой подкисляли посредством добавления 1 н. раствора HCl, экстрагировали 3 раза этилацетатом и промывали один раз насыщенным соевым раствором. После сушки над безводным сульфатом натрия отгоняли растворитель с получением 551,1 мг указанного в заголовке соединения в виде неочищенного белого твердого вещества (выход 65,4%).

30 ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ: 7,78 (д, J = 8,4 Гц, 1H), 7,50 (д, J = 8,8 Гц, 2H), 7,18 (д, J = 8,8 Гц, 2H), 7,05 (д, J = 2,4 Гц, 1H), 7,00 (дд, J = 8,4, 2,4 Гц, 1H).

[0147] Синтез метил 2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)-2-оксоацетата

35 Добавляли 177 мг 2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)-2-оксоуксусной кислоты и 1,1 мл DMF и растворяли в круглодонной колбе на 100 мл, добавляли 223 мг карбоната цезия и 57 мкл йодида метила и перемешивали смесь. Через час после начала реакции добавляли насыщенный водный раствор хлорида аммония для остановки реакции и смесь экстрагировали толуолом 3 раза.

Экстракт промывали 3 раза водой и один раз насыщенным соевым раствором. После
высушивания экстракта безводным сульфатом натрия растворитель отгоняли с получением
171,5 мг бесцветного жидкого неочищенного продукта сложного α -кетоефира. Данный продукт
5 очищали посредством колоночной хроматографии (5 г силикагеля, гексан: этилацетат = 9: 1) с
получением 161,4 мг (выход 87,1%) указанного в заголовке соединения в виде бесцветного
вязкого жидкого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ : 7,87 (д, J = 8,7 Гц, 1H), 7,36 (д, J = 8,9 Гц, 2H), 7,03-6,97 (м, 3H),
6,87 (дд, J = 8,7, 2,5 Гц, 1H), 3,91 (с, 3H). ^{13}C ЯМР (100 МГц, CDCl_3) δ : 165,3, 160,5, 153,6, 135,8,
10 133,4, 130,2, 129,7, 124,0, 121,5, 120,2, 119,8, 115,5, 52,3.

[0148] Синтез метил 2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)оксиан-2-карбоксилата

Добавляли 130,4 мг метил 2- (2-хлор-4-(4-хлорфенокси) фенил) -2-оксоацетата, 68 мкл
15 дииодметана и 1,0 мл THF и растворяли в круглодонной колбе на 50 мл, смесь охлаждали на
бане с сухим льдом и ацетоном, добавляли 0,68 мл изопропилмагнийхлорида и продолжали
перемешивание. Через 0,5 часа после начала реакции добавляли насыщенный водный раствор
хлорида аммония для остановки реакции и смесь экстрагировали этилацетатом 3 раза. Экстракт
20 промывали 1 раз водой и один раз насыщенным соевым раствором. После сушки над
безводным сульфатом натрия растворитель отгоняли с получением 187,1 мг бесцветного
жидкого сырого продукта метил 2-(2-хлор-4- (4-хлорфенокси) фенил)оксиан-2-карбоксилата.
Продукт очищали посредством колоночной хроматографии (6 г силикагеля, гексан: этилацетат
= 9: 1) с получением 91,6 мг бесцветной вязкой жидкости указанного в заголовке соединения.

25 [0149] Синтез метил 2-гидрокси-2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)-3-(1H-1,2,4-триазол-1-
ил)пропаноата (I-1)

Добавляли 91,6 мг метил 2-(2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил)оксиан-2-карбоксилата и 1,2 мл
DMF и растворяли в круглодонной колбе на 100 мл, добавляли 43,7 мг соли триазола натрия,
температуру поднимали до 40°C и смесь перемешивали. Из реакционной смеси надлежащим
30 образом отбирали пробу с последующей ВЭЖХ. Через 4 часа после начала реакции добавляли
насыщенный водный раствор хлорида аммония для остановки реакции и смесь экстрагировали
толуолом 3 раза. Экстракт промывали 3 раза водой и один раз насыщенным соевым раствором.
После высушивания экстракта безводным сульфатом натрия растворитель отгоняли с
получением 187 мг бесцветного жидкого неочищенного продукта. Продукт очищали
35 посредством колоночной хроматографии (2 г силикагеля, гексан: этилацетат = 1: 1) с
получением 27,0 мг бесцветной вязкой жидкой смеси. Ее кристаллизовали в толуоле с
получением 12,8 мг белого твердого вещества производного азоло I-1, представленного общей

формулой (Ia), в которой R² представляет собой метокси (OMe), (R³)_n представляет собой 2-хлор и (R⁴)_m представляет собой 4-хлор.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ: 8,00 (с, 1H), 7,88 (с, 1H), 7,40 (д, J = 8,8 Гц, 1H), 7,34 (д, J = 8,7 Гц, 2H), 6,99-6,95 (м, 3H), 6,81 (дд, J = 8,8 Гц, 1H), 5,0 (д, J = 14,3 Гц, 1H), 4,93 (д, J = 14,3 Гц, 1H), 4,88 (уш., 1H), 3,80 (с, 3H).

[0150] <Пример синтеза 2 Синтез другого производного азола>

Производные азола I-23, I-122 и I-228 синтезировали путем соответствующего изменения используемых соединений и условий в примере синтеза I, описанном выше.

[0151] <Пример испытания 1: эффекты для борьбы против ржавчины листьев пшеницы с использованием производного азола I-1 и фунгицида азоксистробина в качестве ингибитора дыхания>

В настоящем примере испытания испытывали эффект смеси производного азола I-1 и азоксистробина против ржавчины листьев пшеницы (*Puccinia recondita*).

[0152] Химический раствор, содержащий только производное азола I-1, азоксистробин или производное азола I-1 и азоксистробин, разбавляли и суспендировали в воде до заданной концентрации, распыляли со скоростью 1000 л/га и распыляли на молодые проростки на второй листовой стадии (разновидность: №61, по три емкости на одну обработанную область), выращенные в квадратных пластиковых емкостях (6 см × 6 см). После выдерживания опрысканных листьев при комнатной температуре в течение примерно 1 часа для высыхания на воздухе растения инокулировали суспензией летних спор грибов (1 × 10⁵ спор/мл), собранной с листьев пшеницы, пораженных ржавчиной листьев пшеницы, и выдерживали в термостатической камере при 20°C в течение 15 часов. Затем растения переносили в стеклопакет и выращивали и спустя 14 дней, степень начала исследовали с использованием индекса заболевания, основанного на «Нормах для разных степеней болезни ржавчины пшеницы и мелкой ржавчины» Японской ассоциации по защите растений. Шкала испытаний составляла 3 горшка на обработанную площадь. В качестве контроля такую же суспензию *Puccinia recondita*, как описано выше, распыляли и инокулировали без распыления химического раствора, и скорость контроля рассчитывали по следующей формуле.

Показатель контроля (%) = (1 - средний показатель заболеваемости в обработанной химическим средством области/средний показатель заболеваемости в необработанной области) × 100

Далее определяли синергический эффект двух типов соединений с использованием способа, в котором используется формула Колби (формула приведена ниже):

5
$$\text{Скорость контроля при смешивании и распылении (теоретическое значение)} = \alpha + ((100-\alpha) \times \beta / 100$$

Результаты представлены в таблице 2. В приведенной выше формуле α и β представляют собой скорость контроля при распылении каждого соединения по отдельности.

10 [0153] Как показано в таблице 2, скорость контроля смеси производного азота I-1 и азоксистробина была выше, чем теоретическое значение, рассчитанное по скорости контроля при каждом распылении отдельно, что указывает на синергический эффект производного азота I-1 и азоксистробина.

15 [0154] [Таблица 2]

Влияние смешивания производного азота и азоксистробина на ржавчину листьев пшеницы

Производное азота I-1 г/га	Азоксистробин г/га	Фактический коэффициент борьбы	Ожидаемый коэффициент борьбы
2,5	1,25	99	91
1,25	1,25	76	68
0,63	1,25	72	55
0	1,25	47	
2,5	0	83	
1,25	0	40	
0,63	0	16	
0	0	0	

< Пример испытания 2: Испытание эффективности борьбы с ржавчиной листьев пшеницы с использованием производного азота I-1 и фунгицидного пидифлуметофена в качестве ингибитора дыхания >

20

В настоящем примере испытания испытывали эффект смеси производного азота I-1 и пидифлуметофена против ржавчины листьев пшеницы.

[0155] Способ испытания, способ оценки и другие были такими же, как и в примере испытания 1 выше, за исключением того, что состав химических веществ был изменен, как показано в таблице 3. Результаты представлены в таблице 3.

5 [0156] Как показано в таблице 3, скорость контроля смеси производного азота I-1 и пидифлуметофена была выше, чем теоретическое значение, рассчитанное по скорости контроля при каждом распылении химического вещества отдельно, что указывает на синергический эффект производного азота I-1 и пидифлуметофена.

10 [0157] [Таблица 3]

Влияние смешивания производного азота и пидифлуметофена на ржавчину листьев пшеницы

Производное азота I-1 г/га	Пидифлуметофен г/га	Фактический коэффициент борьбы	Ожидаемый коэффициент борьбы
1,25	10	100	94
0,63	10	98	85
0	10	83	
1,25	5	99	89
0,63	5	94	70
0	5	67	
1,25	2,5	94	81
0,63	2,5	67	51
0	2,5	44	
1,25	1,25	98	81
0,63	1,25	83	51
0	1,25	44	
1,25	0,63	96	70
0,63	0,63	83	21
0	0,63	11	
2,5	0	98	
1,25	0	67	
0,63	0	11	
0	0	0	

< Пример испытания 3. Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азота I-1 и карбендазима >

В настоящем примере испытания испытывали антибактериальную активность смешанной композиции производного азола I-1 и карбендазима против *Rugenophora teres*.

5 [0158] Производное азола I-1 отдельно, карбендазим отдельно или комбинацию производного азола I-1 и карбендазима смешивали в среде PDA (картофельная декстрозная агаровая среда) до заданной концентрации с получением таким образом среды в чашках, содержащей химические вещества. Помимо этого, *Rugenophora teres*, предварительно культивированные на планшетных средах, не содержащих химикатов, вырезали сверлом для пробки диаметром 4 мм и инокулировали на планшетные среды PDA, содержащие химические вещества. Через три дня инкубации при 25°C измеряли диаметр растущих колоний и сравнивали его с диаметром колоний в не содержащей химических веществ среде для получения коэффициента ингибирования роста грибов по следующей формуле:

15
$$R = 100 (dc - dt) / dc$$

В приведенной выше формуле R представляет собой коэффициент ингибирования роста грибов (%), dc представляет собой диаметр колонии на чашке без химических веществ, а dt представляет собой диаметр колонии на планшете с химическими веществами. Далее определяли синергический эффект двух типов соединений с использованием способа, в котором используется формула Колби (формула приведена ниже):

25 Коэффициент ингибирования при смешивании для применения (теоретическое значение) = $\alpha + ((100-\alpha) \times \beta) / 100$

В приведенной выше формуле α и β представляют собой коэффициент ингибирования при использовании каждого соединения по отдельности. Результаты представлены в таблице 4.

30 [0159] Как показано в таблице 4, коэффициент ингибирования роста грибов смесью производного азола I-1 и карбендазима был выше, чем теоретическое значение, рассчитанное по коэффициенту ингибирования при использовании каждого из компонентов по отдельности, что указывает на синергический эффект производного азола I-1 и карбендазима.

[0160] [Таблица 4]

Противомикробная активность каждого соединения против *Rugenophora teres*

Производное азола I-1	Карбендазим	Фактический коэффициент ингибирования роста	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста
-----------------------	-------------	---	---

ppm	ppm	грибков (%)	грибков (%)
		%	%
0,25	40	73	55
0,25	10	71	55
0,25	2,5	68	51
0,25	0,625	65	48
0	40	14	
0	10	13	
0	2,5	6	
0	0,625	0	
0,25	0	48	

< Пример испытания 4. Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азола I-1 и пентипирада >

- 5 В настоящем примере испытания испытывали антибактериальную активность смешанной композиции производного азола I-1 и пентипирада против *Fusarium graminearum* S. str.

[0161] Способ испытания, способ оценки и другие были такими же, как и в примере испытания 3 выше, за исключением того, что состав химических веществ был изменен, как
10 показано в таблице 3. Результаты представлены в таблице 5.

[0162] Как показано в таблице 5, коэффициент ингибирования роста грибков смесью производного азола I-1 и пентипирада был выше, чем теоретическое значение, рассчитанное по коэффициенту ингибирования при использовании каждого химического вещества по
15 отдельности, что указывает на синергический эффект производного азола I-1 и пентипирада.

[0163] [Таблица 5]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium graminearum*

Производное азола I-1	Пентипирад	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,25	20	38	28
0,25	5	45	22
0,25	1,25	46	7
0	20	28	

0	5	22
0	1,25	7
0,25	0	0

Примеры испытания 5-22. Испытание противомикробной активности *in vitro* с использованием производного азола I-1 и других фунгицидов

- 5 В данном примере испытания испытывали противомикробную активность смешанного препарата производного азола I-1 и других фунгицидов (трифлуксистеробина, флуоксастробина, флуопирама, биксафена, спирокарма, протиокназола, мефентрифлуконазола, метилтетрапрола и метконазола) против патогенных для растений грибов (*Pyrenophora graminea*, *Gaeumannomyces graminis*, *Alternaria alternata* apple pathrouges, *Fusarium fujikuroi* и *Glomerella cingulata*), перечисленных в следующих таблицах.

15 [0164] Способ испытания, способ оценки и другие являются такими же, как и в примере испытания 3 выше, за исключением того, что состав химического вещества, смешиваемого с производным азола I-1 был изменен, и виды грибов были изменены. Результаты представлены в таблицах 6-23.

20 [0165] Как показано в таблицах 6-23, коэффициент ингибирования роста грибов смеси производного азола I-1 и трифлуксистеробина, флуоксастробина, флуопирама, биксафена, спирокарма, протиокназола, мефентрифлуконазола, метилтетрапрола или метконазола был больше теоретического значения, рассчитанного по коэффициенту ингибирования при использовании каждого химического вещества отдельно, что указывает на синергический эффект производного азола I-1 и данных фунгицидов.

[Таблица 6]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Pyrenophora graminea*

Производное азота I-1	Трифлуксистеробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	94	
0,13	0	81	
0,03	0	71	
0	0,50	54	

0,50	0,50	100	97
0,13	0,50	99	91
0,03	0,50	90	86

[Таблица 7]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азола I-1	Трифлуксистеробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	31	
0	0,50	15	
0,03	0,50	47	42
0	0,002	8	
0,03	0,002	54	36

[Таблица 8]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*

Производное азола I-1	Трифлуксистеробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	0	
0,01	0	0	
0	0,13	48	
0,03	0,13	59	48
0,01	0,13	50	48

5

[Таблица 9]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Rhizoglyphus graminea*

Производное азола I-1	Флуоксастеробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	95	

0,13	0	80	
0,03	0	70	
0	0,50	55	
0,50	0,50	100	98
0,13	0,50	98	91
0,03	0,50	88	86

[Таблица 10]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-1	Флуоксастробин ppm	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
		%	%
0,03	0	28	
0	0,01	0	
0,03	0,01	41	28

[Таблица 11]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*

Производное азота I-1	Флуоксастробин ppm	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
		%	%
0,13	0	1	
0,03	0	0	
0,01	0	0	
0	0,13	48	
0,13	0,13	54	48
0,03	0,13	56	48
0,01	0,13	51	48

5

[Таблица 12]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium fujikuroi*

Производное азота I-1	Флуопирам	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)

ppm	ppm	%	%
0,50	0	59	
0	0,50	21	
0,50	0,50	70	67
0	0,03	6	
0,50	0,03	73	61

[Таблица 13]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-1	Флуопирам	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	77	
0	0,50	9	
0,50	0,50	87	79
0	0,13	3	
0,50	0,13	86	78

[Таблица 14]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium fujikuroi*

Производное азола I-1	Бикафен	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	4	
0,01	0	0	
0	0,50	19	
0,03	0,50	37	22
0,01	0,50	28	19
0	0,13	13	
0,03	0,13	30	16
0,01	0,13	30	13

5

[Таблица 15]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*

Производное азота I-1	Биксафен	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	0	
0,03	0	0	
0,01	0	0	
0	0,03	14	
0,13	0,03	24	14
0,03	0,03	24	14
0,01	0,03	28	14

[Таблица 16]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Rugophora graminea*

Производное азота I-1	Спироксамин	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	93	
0,13	0	57	
0	0,03	0	
0,50	0,03	97	93
0,13	0,03	66	57
0	0,01	0	
0,50	0,01	100	93
0,13	0,01	73	57

[Таблица 17]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-1	Спироксамин	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	94	
0	0,13	0	
0,13	0,13	96	94
0	0,002	0	

0,13

0,002

98

94

[Таблица 18]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Rugophora graminea*

Производное азота I-1	Протиоконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	94	
0,13	0	81	
0,03	0	71	
0	0,50	54	
0,50	0,50	100	97
0,13	0,50	99	91
0,03	0,50	90	86

[Таблица 19]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблوك *Alternaria alternata*

Производное азота I-1	Протиоконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	0	
0	0,13	48	
0,03	0,13	59	48

5

[Таблица 20]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-1	Мефентрифлуконазол	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%

0,13	0	93	
0,03	0	28	
0	0,01	0	
0,13	0,01	98	93
0,03	0,01	42	28
0	0,002	0	
0,13	0,002	98	93
0,03	0,002	34	28

[Таблица 21]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-1	Мефентрифлуконазол	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	75	
0,13	0	49	
0	0,03	41	
0,50	0,03	89	86
0,13	0,03	81	70
0	0,01	17	
0,50	0,01	86	79
0,13	0,01	67	57

[Таблица 22]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Ryzenophora graminea*

Производное азола I-1	Метилтетрапрол	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	82	
0,03	0	68	
0,01	0	37	
0	0,001	0	
0,13	0,001	86	82
0,03	0,001	77	68

0,01

0,001

43

37

[0166] [Таблица 23]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-1	Метконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	9	
0,01	0	0	
0	0,01	28	
0,03	0,01	47	32
0,01	0,01	33	24
0	0,003	7	
0,03	0,003	31	15
0,01	0,003	7	6
0	0,001	4	
0,03	0,001	23	13
0,01	0,001	7	4

5 < Примеры испытания 23-26: Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азола I-1 и других фунгицидов >

10 В настоящем примере испытания испытывали противомикробную активность смешанных составов производного азола I-1 и других фунгицидов (изофлуципрама, фенпикоксамида и метилтетрапрола) против патогенного грибка растений (*Cercospora beticola* и *Colletotrichum lindemuthianum*), перечисленных в таблицах ниже.

15 [0167] Производное азола I-1 отдельно, другой фунгицид (изофлуципрам, фенпикоксамид или метилтетрапрол) отдельно или комбинацию производного азола I-1 и другого фунгицида (изофлуципрам, фенпикоксамид или метилтетрапрол) в заданных концентрациях растворяли в метаноле и поверхностно-активном веществе (алкилаллилполигликолевый эфир). По 10 мкл
20 каждого раствора по капле добавляли в каждую лунку 96-луночного микропланшета и растворитель высушивали в вытяжном шкафу. В каждую лунку добавляли по 100 мкл картофельной декстрозной среды и суспензию спор или мицелия патогенного грибка растений (*Cercospora beticola* или *Colletotrichum lindemuthianum*), перемешивали и инкубировали при 20°C и 85% влажности. Через 3-5 дней инкубации поглощение в каждой лунке измеряли на

длине волны 620 нм. Поглощение сравнивали с поглощением лунок, содержащих не содержащую химических веществ среду, и коэффициент ингибирования роста определяли по следующей формуле:

$$5 \quad R' = 100 (dc' - dt')/dc'$$

В приведенной выше формуле R' представляет собой коэффициент ингибирования роста (%), dc' представляет собой поглощение не содержащей химические вещества лунки, а dt' представляет собой поглощение содержащей химические вещества лунки. Далее определяли синергический эффект двух соединений таким же образом, как и в примере испытания 3, посредством способа с использованием формулы Колби. Если рост равен росту или превышает рост грибка в не содержащей химические вещества среде, коэффициент ингибирования составляет 0%, а если рост не наблюдается, коэффициент ингибирования составляет 100%. Результаты представлены в таблицах 24-27.

10 [0168] Как показано в таблицах 24-27, коэффициент ингибирования роста смеси производного азота I-1 и изофлуципрама, фенпикоксамида или метилтетрапрола был выше, чем теоретическое значение, рассчитанное по коэффициенту ингибирования роста при использовании каждого химического вещества по отдельности, что указывает на синергический эффект производного азота I-1 и данных фунгицидов.

20

[Таблица 24]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Cercospora beticola*

Производное азота I-1 ppm	Изофлуципрам ppm	Фактический коэффициент ингибирования роста %	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста %
0,5	0	6	
0	1,0	48	
0,5	1,0	52	51
0	0,2	0	
0,5	0,2	7	6
0	0,04	3	
0,5	0,04	35	8
0	0,008	7	
0,5	0,008	19	13

[Таблица 25]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Cercospora beticola*

Производное азола I-1 ppm	Фенпиноксамид ppm	Фактический коэффициент ингибирования роста %	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста %
2,5	0	99	
0,02	0	0	
0	5,0	100	
2,5	5,0	100	100
0,02	5,0	100	100
0	1,0	60	
2,5	1,0	100	99
0,02	1,0	71	60
0	0,2	59	
2,5	0,2	100	99
0,02	0,2	59	59
0	0,04	28	
2,5	0,04	100	99
0,02	0,04	42	28

[Таблица 26]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Cercospora beticola*

Производное азола I-1 ppm	Метилтетрапрол ppm	Фактический коэффициент ингибирования роста %	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста %
0,02	0	0	
0	0,08	72	
0,02	0,08	95	72

[0169] [Таблица 27]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Colletotrichum lindemuthianum*

Производное азола I-1 ppm	Метилтетрапрол ppm	Фактический коэффициент ингибирования роста %	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста %
0,10	0	0	
0	2,0	91	
0,1	2,0	98	91
0	0,4	73	

0,1	0,4	75	73
0	0,08	6	
0,1	0,08	31	6

< Примеры испытания 27-38: Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азола I-23 и других фунгицидов >

- 5 В настоящем примере испытания испытывали противомикробную активность смешанной композиции производного азола I-23 и других фунгицидов (бикафена, флуксапироксада, трифлуксистробина, флуоксастробина, протиоконазола и мефентрифлуконазола) против патогенных для растений грибов (*Pyrenophora graminea*, *Fusarium graminearum*, *Gaeumannomyces graminis*, *Penicillium italicum*, *Glomerella cingulata*, *Microcum nivale* и
- 10 болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*), перечисленных в следующих таблицах.

- [0170] Способ испытания, способ оценки и другие являются такими же, как и в примере испытания 3 выше, за исключением того, что состав химического вещества, смешиваемого с
- 15 производным азола I-23 был изменен, и виды грибов были изменены. Результаты представлены в таблицах 28-39.

- [0171] Как показано в таблицах 28-39, коэффициент ингибирования роста грибов смеси производного азола I-23 и бикафена, флуксапироксада, трифлуксистробина, флуоксастробина,
- 20 протиоконазола или мефентрифлуконазола был больше теоретического значения, рассчитанного по коэффициенту ингибирования при использовании каждого химического вещества по отдельности, что указывает на синергетический эффект производного азола I-23 и данных фунгицидов.

- 25 [Таблица 28]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Pyrenophora graminea*

Производное азола I-23	Бикафен	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
1,25	0	95	
0,31	0	92	
0,08	0	73	
0	1,56	75	

1,25	1,56	100	99
0,31	1,56	100	98
0,08	1,56	100	93

[Таблица 29]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium graminearum*

Производное азота I-23	Бикафен	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
5,00	0	79	
0	0,10	6	
5,00	0,10	87	80

[Таблица 30]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-23	Флуксапироксад	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
5,00	0	94	
0,08	0	92	
0	1,56	0	
5,00	1,56	97	94
0,08	1,56	97	92

5

[Таблица 31]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Penicillium italicum*

Производное азота I-23	Трифлуксистробин	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	52	
0,13	0	35	
0,03	0	12	
0,01	0	6	

0	0,50	90	
0,50	0,50	97	95
0,13	0,50	97	94
0,03	0,50	94	92
0,01	0,50	95	91

[Таблица 32]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-23	Трифлуксистеробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	9	
0	0,50	46	
0,03	0,50	72	51

[Таблица 33]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Ryzenophora graminea*

Производное азола I-23	Флуоксастробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	91	
0,13	0	81	
0	0,50	59	
0,50	0,50	100	96
0,13	0,50	95	92
0	0,13	51	
0,50	0,13	100	95
0,13	0,13	98	90

5

[Таблица 34]

Противомикробная активность каждого соединения в *Microdocum nivale*

Производное азола I-23	Флуоксастробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)

ppm	ppm	%	%
0,50	0	27	
0,13	0	4	
0,01	0	0	
0	0,01	96	
0,50	0,01	100	97
0,13	0,01	100	96
0,01	0,01	100	96

[Таблица 35]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-23	Протиоконазол, ppm	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибков (%)	ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	38	
0,01	0	0	
0	0,50	36	
0,03	0,50	91	61
0,01	0,50	52	36
0	0,13	0	
0,03	0,13	95	38
0,01	0,13	33	0

[Таблица 36]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азота I-23	Протиоконазол, ppm	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	61	
0,13	0	31	
0	0,50	24	
0,50	0,50	86	71
0,13	0,50	56	48

[Таблица 37]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Penicillium italicum*

Производное азота I-23	Протиоконазол, ppm	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	43	
0	0,13	18	
0,50	0,13	70	54

[Таблица 38]

Противомикробная активность каждого соединения в *Microdocum nivale*

Производное азота I-23	Мефентрифлуконазол ppm	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	24	
0,13	0	10	
0	0,01	1	
0,50	0,01	32	25
0,13	0,01	28	11

5 [0172] [Таблица 39]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*

Производное азота I-23	Мефентрифлуконазол ppm	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	0	
0,03	0	0	
0	0,50	62	
0,13	0,50	69	62
0,03	0,50	69	62

< Примеры испытания 39-49: Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азола I-122 и других фунгицидов >

- 5 В настоящем примере испытания испытывали противомикробную активность смешанной композиции производного азола I-122 и других фунгицидов (бикафена, флуксапироксада, трифлуксистробина, флуоксастробина, протиоконазола и мефентрифлуконазола) против патогенного грибка растений (*Fusarium graminearum*, *Gaeumannomyces graminis*, *Pyrenophora graminea*, *Microcum nivale*, болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata* и *Glomerella singulata*), перечисленных в следующих таблицах.

[0173] Способ испытания, способ оценки и другие являются такими же, как и в примере испытания 3 выше, за исключением того, что состав химического вещества, смешиваемого с производным азола I-122 был изменен, и виды грибов были изменены. Результаты представлены в таблицах 40-50.

[0174] Как показано в таблицах 40-50, коэффициент ингибирования роста грибов смеси производного азола I-122 и бикафена, флуксапироксада, трифлуксистробина, флуоксастробина, протиоконазола или мефентрифлуконазола был больше теоретического значения, рассчитанного по коэффициенту ингибирования при использовании каждого химического вещества по отдельности, что указывает на синергетический эффект производного азола I-122 и данных фунгицидов.

[Таблица 40]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium graminearum*

Производное азола I-122	Бикафен	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
5,00	0	83	
0	0,10	0	
5,00	0,10	94	83

25

[Таблица 41]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-122	Флуксапироксад	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
1,25	0	96	
0,31	0	96	
0	1,56	0	
1,25	1,56	98	96
0,31	1,56	97	96
0	0,10	0	
1,25	0,10	97	96
0,31	0,10	97	96

[Таблица 42]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Ryzenophora graminea*

Производное азота I-122	Трифлуксистробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	82	
0,13	0	75	
0	0,50	55	
0,50	0,50	100	92
0,13	0,50	95	89
0	0,13	54	
0,50	0,13	100	92
0,13	0,13	92	89

[Таблица 43]

Противомикробная активность каждого соединения в *Microdocum nivale*

Производное азота I-122	Трифлуксистробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибов (%)	коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%

0,13	0	4	
0,03	0	0	
0,01	0	0	
0	0,03	65	
0,13	0,03	69	66
0,03	0,03	70	65
0,01	0,03	77	65

[Таблица 44]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азола I- 122	Трифлуксистеробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	97	
0,13	0	70	
0	0,50	9	
0,50	0,50	100	97
0,13	0,50	74	73

[Таблица 45]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азола I- 122	Флуоксастробин	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	57	
0	0,01	32	
0,13	0,01	100	71

5

[Таблица 46]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении болезнетворного микроорганизма яблок *Alternaria alternata*

Производное азола I-	Флуоксастробин	Фактический	Ожидаемый
----------------------	----------------	-------------	-----------

122		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	5	
0,13	0	0	
0	0,50	43	
0,50	0,50	50	46
0,13	0,50	50	43

[Таблица 47]

Противомикробная активность каждого соединения в *Microdocum nivale*

Производное азола I-122	Протиоконазол,	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	42	
0	0,13	13	
0,50	0,13	64	50

[Таблица 48]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-122	Протиоконазол,	Фактический	Ожидаемый
		коэффициент ингибирования роста грибков (%)	коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	82	
0,13	0	45	
0	0,13	0	
0,50	0,13	84	82
0,13	0,13	55	45
0	0,01	0	
0,50	0,01	87	82
0,13	0,01	55	45

[Таблица 49]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азота I-122	Мефентрифлуконазол	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	32	
0,01	0	0	
0	0,03	19	
0,03	0,03	88	45
0,01	0,03	61	19

[0175] [Таблица 50]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азота I-122	Мефентрифлуконазол	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	14	
0,01	0	8	
0	0,50	77	
0,03	0,50	87	80
0,01	0,50	82	79

- 5 < Примеры испытания 50-59: Испытание противомикробной активности in vitro с использованием производного азота I-228 и других фунгицидов >

В настоящем примере испытания испытывали противомикробную активность смешанной композиции производного азота I-228 и других фунгицидов (биксафена, флуксапироксада, трифлуксистербина, флуоксастробина, протиоконазола и мефентрифлуконазола) против патогенных для растений грибов (*Microcum nivale*, *Gaeumannomyces graminis*, *Fusarium fujikuroi*, *Pyrenophora graminea*, *Glomerella cingulata*, *Fusarium graminearum* и *Penicillium italicum*), перечисленных в следующих таблицах.

- 15 [0176] Способ испытания, способ оценки и другие являются такими же, как и в примере испытания 3 выше, за исключением того, что состав химического вещества, смешиваемого с

производным азола I-228 был изменен, и виды грибов были изменены. Результаты представлены в таблицах 51-60.

5 [0177] Как показано в таблицах 51-60, коэффициент ингибирования роста грибов смеси производного азола I-228 и бикафена, флуксапироксада, трифлуксистербина, флуоксастробина, протиоконазола или мефентрифлуконазола был больше теоретического значения, рассчитанного по коэффициенту ингибирования при использовании каждого химического вещества по отдельности, что указывает на синергетический эффект производного азола I-228 и данных фунгицидов.

10

[Таблица 51]

Противомикробная активность каждого соединения в *Microdocum nivale*

Производное азола I-228	Бикафен	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибов (%)	ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
5,00	0	86	
1,25	0	56	
0	0,10	0	
5,00	0,10	91	86
1,25	0,10	60	56

[Таблица 52]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gasumannomyces graminis*

Производное азола I-228	Флуксапироксад	Фактический коэффициент	Ожидаемый коэффициент
		ингибирования роста грибов (%)	ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
5,00	0	71	
1,25	0	67	
0,31	0	63	
0	1,56	9	
5,00	1,56	96	74
1,25	1,56	96	70
0,31	1,56	92	67

15 [Таблица 53]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Gaeumannomyces graminis*

Производное азола I-228	Трифлуксистробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	89	
0	0,13	11	
0,13	0,13	99	90
0	0,03	5	
0,13	0,03	99	90

[Таблица 54]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium fujikuroi*

Производное азола I-228	Трифлуксистробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	21	
0	0,01	10	
0,50	0,01	54	29
0	0,002	0	
0,50	0,002	66	21

[Таблица 55]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Rhizoglyphus graminea*

Производное азола I-228	Флуоксастробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибов (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибов (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	84	
0	0,50	51	
0,50	0,50	100	92
0	0,13	46	
0,50	0,13	100	91

[Таблица 56]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-228	Флуоксастробин	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	12	
0,01	0	2	
0	0,50	48	
0,03	0,50	60	54
0,01	0,50	57	49

[Таблица 57]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Fusarium graminearum*

Производное азола I-228	Протиоконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	39	
0	0,03	19	
0,50	0,03	61	51
0	0,01	1	
0,50	0,01	47	40

5 [Таблица 58]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-228	Протиоконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,50	0	82	
0	0,03	1	
0,50	0,03	87	82
0	0,01	0	

0,50

0,01

86

82

[Таблица 59]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Penicillium italicum*

Производное азола I-228	Протиоконазол,	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,13	0	56	
0	0,13	19	
0,13	0,13	75	64

[Таблица 60]

Противомикробная активность каждого соединения в отношении *Glomerella Cingulata*

Производное азола I-228	Мефентрифлуконазол	Фактический коэффициент ингибирования роста грибков (%)	Ожидаемый коэффициент ингибирования роста грибков (%)
ppm	ppm	%	%
0,03	0	16	
0,01	0	0	
0	0,13	74	
0,03	0,13	83	78
0,01	0,13	79	74

5

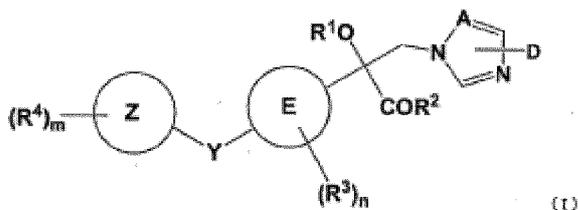
Промышленное применение

[0178] Настоящее изобретение может подходящим образом использоваться в качестве средства контроля для борьбы с болезнями растений, которые могут бороться с болезнями растений при ограничении вредного воздействия на растения.

10

Формула изобретения

1. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид включает производное азола, представленное следующей общей формулой (I), в качестве активного ингредиента, и
 5 дополнительно включает другой активный ингредиент:
 [Химическая формула 1]



- 10 где
 А представляет собой N или CH;
 D представляет собой водород, галогеновую группу или SR^D,
 причем R^D представляет собой водород, цианогруппу, C₁–C₆-алкильную группу, C₁–C₆-галогеналкильную группу, C₂–C₆-алкенильную группу, C₂–C₆-галогеналкенильную группу, C₂–
 15 C₆-алкинильную группу или C₂–C₆-галогеналкинильную группу;
 R¹ представляет собой водород, C₁–C₆-алкильную группу, C₂–C₆-алкенильную группу, C₂–C₆-алкинильную группу, C₃–C₈-циклоалкильную группу, C₃–C₈-циклоалкил-C₁–C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁–C₄-алкильную группу, фенил-C₂–C₄-алкенильную группу, фенил-C₂–C₄-алкинильную группу или COXR⁵.
 20 причем R⁵ представляет собой водород, C₁–C₆-алкильную группу, C₂–C₆-алкенильную группу, C₂–C₆-алкинильную группу, C₃–C₈-циклоалкильную группу, C₃–C₈-циклоалкил-C₁–C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁–C₄-алкильную группу, фенил-C₂–C₄-алкенильную группу или фенил-C₂–C₄-алкинильную группу;
 X представляет собой одинарную связь, –O– или –NR⁶–;
 25 R⁶ представляет собой водород, C₁–C₆-алкильную группу, C₂–C₆-алкенильную группу, C₂–C₆-алкинильную группу, C₃–C₈-циклоалкильную группу, C₃–C₈-циклоалкил-C₁–C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁–C₄-алкильную группу, фенил-C₂–C₄-алкенильную группу или фенил-C₂–C₄-алкинильную группу; а R⁵ и R⁶ могут образовывать кольцо;
 30 R² представляет собой –OR⁷ или –NR⁸R⁹;
 каждый из R⁷, R⁸ и R⁹ независимо представляет собой водород, C₁–C₆-алкильную группу, C₂–C₆-алкенильную группу, C₂–C₆-алкинильную группу, C₃–C₈-циклоалкильную группу, C₃–C₈-циклоалкил-C₁–C₄-алкильную группу, фенильную группу, фенил-C₁–C₄-

алкильную группу, фенил-С₂-С₄-алкенильную группу или фенил-С₂-С₄-алкинильную группу, при этом R⁸ и R⁹ могут образовывать кольцо,

5 причём алифатические группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ могут иметь 1, 2, 3 или возможное максимальное число одинаковых или разных групп R^a, при этом R^a независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, С₁-С₄-алкоксигруппы и С₁-С₄-галогеналкоксигруппы.

10 R⁴ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, аминогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, С₁-С₄-алкильную группу, С₁-С₄-галогеналкильную группу, С₁-С₄-алкоксигруппу или С₁-С₄-галогеналкоксигруппу, С₁-С₄-алкиламиногруппу, С₁-С₄-диалкиламиногруппу, С₁-С₄-алкилациламиногруппу, -SOR¹⁰ или -SF₅;

15 циклоалкиламиногруппа или фрагмент фенильной группы в R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ или фрагмент фенильной группы в R⁴ могут иметь 1, 2, 3, 4, 5 или возможное максимальное количество одинаковых или разных групп R^b, при этом R^b независимо выбраны из галогеновой группы, цианогруппы, нитрогруппы, С₁-С₄-алкильной группы, С₁-С₄-алкоксигруппы, С₁-С₄-галогеналкильной группы и С₁-С₄-галогеналкоксигруппы;

R³ представляет собой галогеновую группу, цианогруппу, нитрогруппу, фенильную группу, фенилоксигруппу, С₁-С₄-алкильную группу, С₁-С₄-галогеналкильную группу, С₁-С₄-алкоксигруппу, С₁-С₄-галогеналкоксигруппу, -SOR¹⁰ или -SF₅;

R¹⁰ представляет собой С₁-С₄-алкильную группу или С₁-С₄-галогеналкильную группу.

20 E представляет собой фенильную группу или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N;

n R³ связаны с любыми положениями замещения; если E представляет собой фенильную группу, то n равно 0, 1, 2, 3 или 4, и если E представляет собой 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома N, то n равно 0, 1 или 2;

25 Y представляет собой атом кислорода, -CH₂O-, -OCH₂-, -NH-, -N(-С₁-С₄-алкил)-, -N(-С₃-С₆-циклоалкил)- или -S(O)_p-, который связан с любыми положениями на E;

p равно 0, 1 или 2;

30 Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, которая представляет собой фенильную или нафтильную группу, 5- или 6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, или 9- или 10-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, состоящее из двух колец;

m R⁴ связаны с любыми положениями замещения;

35 если Z представляет собой ароматическую углеводородную группу, то m равно 1, 2, 3, 4 или 5, а если Z представляет собой ароматическое гетероциклическое кольцо, то m равно 0, 1, 2, 3 или 4.

2. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 1, в котором другой активный ингредиент содержит по меньшей мере один компонент, выбранный из следующих:

(i) активный ингредиент фунгицида, выбранного из следующих: ингибиторы синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот, ингибиторы митотического деления/клеточного деления, ингибиторы дыхания, ингибиторы биосинтеза аминокислот/белков, ингибиторы передачи сигнала, ингибиторы биосинтеза липидов или транспортировки/структуры клеточной мембраны или функции, ингибиторы биосинтеза стерола клеточной мембраны, ингибиторы биосинтеза клеточной стенки, ингибиторы биосинтеза меланина, индукторы устойчивости растения-хозяина и многоцентровые фунгициды;

(ii) активный ингредиент инсектицида, выбранного из модуляторов никотиновых ацетилхолиновых рецепторов, модуляторов натриевых каналов, модуляторов рецепторов риаподина, ингибиторов ацетилхолинэстеразы, разобщающих средств окислительного фосфорилирования и ингибиторов комплекса I митохондриальной цепи переноса электронов; и

(iii) активный ингредиент регулятора роста растений.

3. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор синтеза и метаболизма нуклеиновых кислот содержит по меньшей мере одно вещество, выбранное из беналаксилла, беналаксилла-М, фуралаксилла, офурацилла, бупиримата, диметиримолла, этиримолла, октилинона, металаксилла, металаксилла-М, оксадиаксилла и гимексазола.

4. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор митотического разделения/движущего белка содержит по меньшей мере одно вещество, выбранное из беномила, карбендазима, фуберидазола, тиабендазола, тиофаната, тиофанат-метила, диэтофенкарба, зоксамида, этабоксама, пенцикурона, флупиколида, фенамакрила, метрафенона и пириофенона.

5. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор дыхания содержит по меньшей мере один, выбранный из толфенпирада, дифлуметорима, феназахина, пидифлуметофена, фенфурама, карбоксина, оксикарбоксина, беноданила, флутоланила, мепронила, изофетамида, бензовиндифлупира, биксафена, флуиндапира, флуксапироксада, фураметпира, инпирфлуксама, изопиразама, пенфлуфена, пентиопирада, седаксана, изофлуципрама, боскалида, флуопирама, тифлузамида, пиразифлумида, пирибенкарба, флуоксастробина, фенамидона, мандестробина, азоксистробина, кумоксистробина, эноксастробина, флуфеноксистробина, пикоксистробина, пираоксистробина, триклопирикарба, фенаминстробина, метминостробина, оризастробина, крезоксиметила, трифлуксистробина, циазофамида, амисульброма, фенпикоксамида, флорилпикоксамида, бинапакрила, мептилдинокапа, динокапа, флазуинама, ацетата трифенилова, хлорида трифенилова, гидроксида трифенилова, силтиофама, аметоктрадина, метилтетрапрола, пирпропина и инпирфлуксама.

6. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор биосинтеза аминокислот/белков содержит по меньшей мере один из ципродинила, мепанипирима, пириметанила, бластицидина, касугамицина, стрептомицина и окситетрациклина.

7. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор передачи сигнала содержит по меньшей мере один, выбранный из хиноксифена, проквиназида, хлозолината, диметахлора, фенпиклонила, флудиоксонила, ипродиона, процимидона и винклозолина.

8. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор биосинтеза липидов или транспорта/структуры или функции клеточной мембраны включает по меньшей мере один, выбранный из изопропиолана, эдифенфоса, ипробенфоса (IBP), пиразофоса, бифенила, хлоронеба, дихлорана, хинтозена (PCNB), текназена (TCNB), толклофосметила, этридиазола, протиокарба, пропамокарба, натамицина, оксатиапипролина и флуоксапипролина.

9. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор биосинтеза стерола клеточной мембраны содержит по меньшей мере один, выбранный из имазапила, окспоконазола, пефуразоата, прохлораза, трифлумизола, трифорина, пирифенокса, пиризоксазола, фенаримола, нуаримола, азаконазола, битертанола, бромуконазола, ципроконазола, дифенокконазола, диниконазола эпоксиконазола, этаконазола, фенбукконазола, флуквинконазола, флусилазола, флутриафола, гексаконазола, имибенконазола, метконазола, ипконазола, миклобутанила, пенконазола, пропиконазола, симеконазола, тебукконазола, тетраконазола, триадимефона, триадименола, тритиконазола, мефентрифлуконазола, протиоконазола, тридеморфа, фенпропиморфа, фенпропидина, пипералина, спироксамина, фенпиразамина, фенгексамида, нафтифина, тербинафина, пирибутикарба и ипфентрифлуконазола.

10. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор биосинтеза клеточной стенки содержит по меньшей мере один, выбранный из полиоксина, диметоморфа, флуморфа, пириморфа, мандипропамида, бентиаваликарба, ипроваликарба и валифеналата.

11. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор биосинтеза меланина содержит по меньшей мере один, выбранный из фталида, трициклазола, пирохилона, карпропамида, диклоцимета, феноксанила и толпрокарба.

12. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором индуктор устойчивости растения-хозяина содержит по меньшей мере один, выбранный из ацибензолар-S-метила, пробеназола, триадинила, ламинарина, изотианила, ламинарина, фосетила-Al, фосфорной кислоты и фосфонатов.

13. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором многоцентровый фунгицид включает по меньшей мере один фунгицид, выбранный из цимоксанила, теклофтала, триазоксида, флусульфамида, дикломезина, цифлуфенамида, додина, флутианила, феримзона, тебуфлохина, пикарбутразокса, валидамицина, минерального масла, пищевой соды, карбоната калия, меди и соединений меди, серы, фербама, манкоцеба, манеба, метрима, пропинеба, тирама, цирама, каптана, каптафола, фолпетта, хлорталонила (TPN), гуазатина, иминоктадина ацетата, иминоктадина альбезилата, анилазина, дитианона, фторимида, метасульфокарба, флорилпикоксамида, флуопимомида, ипфлуфенохина, хинометионата, пиридахлометила, аминопирифена, дихлобентиазокса, хинофумелина и дипиметитрона.

14. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором модулятор, являющийся антагонистом никотинового ацетилхолинового рецептора, содержит по меньшей мере один, выбранный из ацетамиприда, клотианидина, динотефурана, имидаклоприда, нитифенпирама, тиаклоприда, тиаметоксама, сульфоксахлора, флупирадифурона и трифлумезопира.

15. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором модулятор натриевых каналов содержит по меньшей мере одно пиретроидное соединение, выбранное из актина, алкантрина, циперметрина, бифентрина, циклопротрина, цигалотрина, циперметрина, дельгаметрина, димефлутрина, эсфенвалерата, этофенпрокса, фенпропарина, фенвалерата, флубромцитрината, флуцитрината, флувалината, галофенпрокса, цигалотрина, метофлутрина, момфтортрин, перметрина, профлутрина, тефлутрина, тралометрина, цифлутрина, бифентрина, имипротрина, пиретрина, цифенотина, хлорпалтрина, эпсилон-метофлутрина и эпсилон-мофтортрина.

16. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором модулятор рецептора рианодина содержит по меньшей мере один, выбранный из хлорантранилипрола, циантранилипрола, флубендиамида и цигалодиамида.

17. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор ацетилхолинэстеразы содержит по меньшей мере один, выбранный из ацефата,

азинофосметила, кадзафоса, хлоретоксифоса, хлорфенвинфоса, хлорпирифоса, цианофоса, деметон-S-метила, диазинона, дихлорвоса (DDVP), дикротофоса, диметоата, дисульфотона, этиона, этопрофоса, EPN, фенамифоса, фенитротиона (MEP), фентиона (MPP), фостиазата, имициафоса, изофенфоса, изоксатиона, малатиона, метамидофоса, метидатиона, мевинфоса, 5 монокротофоса, омететоата, оксидеметон-метила, паратиона, паратион-метила, фентоата, фората, фосалона, фосмета, фосфамидона, фоксима, пиримифос-метила, профенофоса, протиофоса, пиралофоса, пиридафентиона, хиналфоса, тебупиримфоса, тербуфоса, триазофоса, трихлорфона (DEP), аланакарба, алдикарба, бенфуракарба, ВРМС, карбарила (NAC), карбофурана, карбосульфана, картапа, феноксикарба (ВРМС), форметаната, изопрокарба 10 (MIPC), метиокарба, метомила, оксамила, пиримикарба, тиодикарба, ХМС, бендиокарба, этиофенкарба, фенобукарба, фенотиокарба, фуратиокарба, метолкарба и ксиллкарба.

18. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором разобшающее средство окислительного фосфорилирования включает по меньшей мере одно соединение, 15 выбранное из хлорфенапира, DNOC и сульфлурамида.

19. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором ингибитор комплекса I цепи митохондриального транспорта электронов включает по меньшей мере один, 20 выбранный из тебуфенпирада, толфенпирада, феназахина, фенпироксимата, пиридабена, пиримидифена и ротенона.

20. Сельскохозяйственный или садоводческий фунгицид по п. 2, в котором активный ингредиент регулятора роста растений содержит по меньшей мере один, выбранный из 25 аминэтоксивинилглицина, хлормеквата, хлорпрофама, цикланилида, дикетулака, даминозида, этефона, флурпримидола, флуметралина, форхлорфенурана, гибберелина, гидразида малеата, мепиквата хлорида, метилциклопропена, бензиламинопурина, паклобутразола, прогексадиона, тидиазурана, трибутилфосфоротритиоата, тринексапак-этила и униказола.

21. Способ борьбы с болезнями растений, включающий обработку листвы или других 30 способов обработки с использованием сельскохозяйственного или садоводческого химического средства, описанного в любом из пп. 1–20.

22. Продукт для борьбы с болезнями растений для получения сельскохозяйственного или садоводческого фунгицида по любому из пп. 1–20, содержащий производное азота и другой 35 активный ингредиент отдельно в качестве комбинированного препарата, подлежащего смешиванию перед применением.