

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202293525** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.03.22

(51) Int. Cl. *C07D 417/14* (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2021.05.27

(54) МИКРОБИОЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ

(31) 20178038.4

(32) 2020.06.03

(33) EP

(86) PCT/EP2021/064263

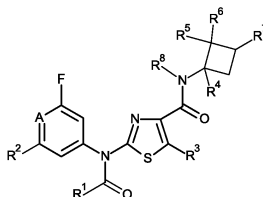
(87) WO 2021/244952 2021.12.09

(71) Заявитель:
СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)

(72) Изобретатель:
Эдмундс Эндрю (CH)

(74) Представитель:
**Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU)**

(57) Соединения формулы (I), где заместители являются такими, как определено в п.1, применимые в качестве пестицидов и особенно в качестве фунгицидов.



202293525

A1

A1

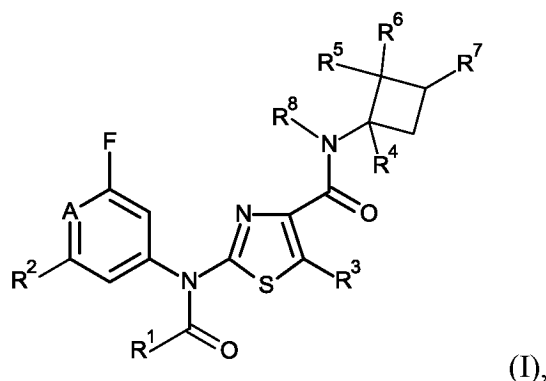
202293525

МИКРОБИОЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ

Настоящее изобретение относится к микробицидным тиазольным производным, например, таким как активные ингредиенты, которые обладают микробицидной активностью, в частности фунгицидной активностью. Настоящее изобретение также относится к получению таких тиазольных производных, к агрохимическим композициям, которые содержат по меньшей мере одно из тиазольных производных, и к вариантам применения тиазольных производных или композиций на их основе в сельском хозяйстве или садоводстве для контроля или предупреждения заражения растений, собранных продовольственных сельскохозяйственных культур, семян или неживых материалов фитопатогенными микроорганизмами, преимущественно грибами.

В WO 2010/012793 и WO 2017/207362 описаны тиазольные производные в качестве пестицидных средств.

В соответствии с настоящим изобретением предусмотрено соединение формулы (I),



где
 А представляет собой С-Н или N;
 R¹ представляет собой C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;
 R² представляет собой водород или галоген;

R^3 представляет собой C_1 - C_8 алкил;

каждый из R^4 , R^5 , R^6 независимо представляет собой водород или C_1 - C_4 алкил;

R^7 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил или C_1 - C_6 алкокси;

5 R^8 представляет собой водород, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфанил C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности
10 выбранные из азота, кислорода и серы;
или его соль или N-оксид.

В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения предусмотрена агрохимическая композиция, содержащая фунгицидно эффективное количество соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением. Такая композиция,
15 предназначенная для применения в сельском хозяйстве, может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент и/или агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

В соответствии с третьим аспектом настоящего изобретения предусмотрен способ контроля или предупреждения заражения полезных растений фитопатогенными микроорганизмами, где фунгицидно эффективное количество соединения формулы (I) или композиции, содержащей данное соединение в качестве активного ингредиента, применяют в отношении растений, их частей или их места произрастания.
20

В соответствии с четвертым аспектом настоящего изобретения предусмотрено применение соединения формулы (I) в качестве фунгицида. В соответствии с данным конкретным аспектом настоящего изобретения применение может включать или может не включать способы лечения организма человека или животного посредством хирургического вмешательства или терапии.
25

Применяемый в данном документе термин "галоген" относится к фтору (фторо), хлору (хлоро), бромю (бromo) или йоду (йодо).

30 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_8 алкил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему исключительно из атомов углерода и водорода, не содержащему ненасыщенных связей, содержащему от одного до восьми атомов углерода и который присоединен к остальной части молекулы посредством одинарной связи. " C_1 - C_6 алкил", " C_1 - C_4 алкил" и

"C₁-C₃алкил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₈алкила включают без ограничения метил, этил, н-пропил и их изомеры, например изопропил. "C₁-C₆алкиленовая" группа относится к соответствующему определению C₁-C₆алкила, за исключением того, что такой радикал присоединен к остальной части молекулы посредством двух одинарных связей.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины "C₁-C₄алкокси" и "C₁-C₃алкокси" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆алкокси включают без ограничения метокси, этокси, 1-метилэтокси (изопропокси) и пропокси.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкил" относится к радикалу формулы R_bOR_a-, где R_b представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше. "C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкил", "C₁-C₄алкоксиC₁-C₄алкил", "C₁-C₄алкоксиC₁-C₃алкил", "C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил" и "C₃-C₄алкоксиC₁-C₂алкил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкила включают без ограничения изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксикарбонил" относится к радикалу формулы R_aOC(O)-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше. "C₁-C₄алкоксикарбонил" и "C₁-C₃алкоксикарбонил" следует истолковывать соответствующим образом.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксикарбонилC₁-C₄алкил" относится к радикалу формулы R_aOC(O)R_b-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₄алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкилкарбонил" относится к радикалу формулы R_aOR_bC(O)-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкил" относится к радикалу формулы R_aSR_b-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкил" относится к радикалу формулы R_aS(O)R_b-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

5 Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкилкарбонил" относится к радикалу формулы R_aSR_bC(O)-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

10 Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкилкарбонил" относится к радикалу формулы R_aS(O)R_bC(O)-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

15 Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкилкарбонил" относится к радикалу формулы R_aS(O)₂R_bC(O)-, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_b представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

20 Применяемый в данном документе термин "гетероциклил" относится к стабильному 4-, 5- или 6-членному неароматическому моноциклическому кольцу, которое содержит 1, 2 или 3 гетероатома, при этом гетероатомы по отдельности выбраны из азота, кислорода и серы. Гетероциклильный радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероциклила включают без ограничения азиридины, азетидины, оксетаны, тияны, тетрагидрофуры, пирролидины, пиазолидины, имидазолидины, пиперидины, пиперазины, морфолины, диоксоланы, дитиоланы и тиазолидины.

25 Применяемый в данном документе термин "гетероциклилкарбонил" относится к радикалу формулы R_aC(O)-, где R_a представляет собой гетероциклильный фрагмент, как определено выше.

30 Наличие одного или нескольких возможных асимметричных атомов углерода в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в оптически изомерных формах, т. е. энантиомерных или диастереомерных формах. Также могут встречаться атропоизомеры в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Предполагается, что формула (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси. Аналогично предполагается, что формула

(I) включает все возможные таутомеры. Настоящее изобретение включает все возможные таутомерные формы соединения формулы (I).

В каждом случае соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением находятся в свободной форме, в окисленной форме в виде N-оксида или в форме соли, например, в форме агрономически применимой соли.

N-оксиды представляют собой окисленные формы третичных аминов или окисленные формы азотсодержащих гетероароматических соединений. Они описаны, например, в книге "Heterocyclic N-oxides", A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton (1991).

В следующем перечне представлены определения, в том числе предпочтительные определения, для заместителей A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ и R⁸ со ссылкой на соединения формулы (I). Применительно к любому из этих заместителей любое из определений, приведенных ниже, можно комбинировать с любым определением любого другого заместителя, приведенным ниже или в других частях данного документа.

A представляет собой C-H или N. В одной группе вариантов осуществления A представляет собой C-H. В другой группе вариантов осуществления A представляет собой N.

R¹ представляет собой C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкил или гетероцикл, где гетероциклический фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

Предпочтительно R¹ представляет собой C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₃алкилсульфанилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфинилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфонилC₁-C₃алкил или гетероцикл, где гетероциклический фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

Более предпочтительно R¹ представляет собой C₁-C₃алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₃алкилсульфанилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфинилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфонилC₁-C₃алкил или гетероцикл, где гетероциклический фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода.

Еще более предпочтительно R^1 представляет собой C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

Еще более предпочтительно R^1 представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

В дополнительном предпочтительном варианте осуществления R^1 представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил или тетрагидропиран-4-ил.

В одном варианте осуществления R^1 представляет собой C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфанил C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

Предпочтительно R^1 представляет собой C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкилсульфанил C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкилсульфинил C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкилсульфонил C_1 - C_4 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

Более предпочтительно R^1 представляет собой C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

Еще более предпочтительно R^1 представляет собой C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 -

С₃алкилсульфонилС₁-С₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода.

5 Еще более предпочтительно R¹ представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, 1-метилсульфанилэтил, 1-метилсульфинилэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил.

10 Наиболее предпочтительно R¹ представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил.

В одной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой С₁-С₆алкилсульфанилС₁-С₆алкил, С₁-С₆алкилсульфинилС₁-С₆алкил, С₁-С₆алкилсульфонилС₁-С₆алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

20 В другой группе вариантов осуществления R¹ представляет собой С₁-С₄алкилсульфанилС₁-С₄алкил, С₁-С₄алкилсульфинилС₁-С₄алкил, С₁-С₄алкилсульфонилС₁-С₄алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

25 В дополнительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой С₁-С₃алкилсульфанилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфинилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфонилС₁-С₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

30 В дополнительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой С₁-С₃алкилсульфанилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфинилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфонилС₁-С₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

В еще более дополнительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой С₁-С₃алкилсульфанилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфинилС₁-С₃алкил, С₁-

С₃алкилсульфонилС₁-С₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода.

В предпочтительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил или тетрагидропиран-4-ил.

В более предпочтительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, 1-метилсульфинилэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил.

В наиболее предпочтительной группе вариантов осуществления R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил.

В дополнительной группе предпочтительных вариантов осуществления R¹ представляет собой С₃-С₄алкоксиС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфанилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфинилС₁-С₃алкил, С₁-С₃алкилсульфонилС₁-С₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

Предпочтительно R¹ представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, 1-метилсульфанилэтил, 1-метилсульфинилэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил. Более предпочтительно R¹ представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-изопропоксиэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил или тетрагидрофуран-3-ил.

R² представляет собой водород или галоген. Предпочтительно R² представляет собой водород, хлор, бром или фтор. Более предпочтительно R² представляет собой водород или фтор. В одной группе вариантов осуществления R² представляет собой водород. В дополнительной группе вариантов осуществления R² представляет собой фтор.

R³ представляет собой С₁-С₈алкил. Предпочтительно R³ представляет собой С₁-С₆алкил. Более предпочтительно R³ представляет собой С₁-С₃алкил. Еще более предпочтительно R³ представляет собой метил, этил или изопропил. Наиболее предпочтительно R³ представляет собой метил.

Каждый из R^4 , R^5 , R^6 независимо представляет собой водород или C_1 - C_4 алкил. Предпочтительно каждый из R^4 , R^5 , R^6 независимо представляет собой водород или C_1 - C_3 алкил. Более предпочтительно каждый из R^4 , R^5 , R^6 независимо представляет собой водород или метил.

5 В одной группе вариантов осуществления R^4 представляет собой водород, и R^5 и R^6 одновременно представляют собой метил.

R^7 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил или C_1 - C_6 алкокси. Предпочтительно R^7 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил или C_1 -
10 C_4 алкокси. Более предпочтительно R^7 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкоксикарбонил, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_3 алкоксикарбонил или C_1 - C_3 алкокси. Еще более предпочтительно R^7 представляет собой водород, метил, метоксикарбонилметил, метоксикарбонил или метокси. Еще более предпочтительно R^7 представляет собой водород или метил, наиболее предпочтительно R^7 представляет собой водород.

15 R^8 представляет собой водород, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности
20 выбранные из азота, кислорода и серы.

Предпочтительно R^8 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкилсульфанил, C_1 - C_4 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или
25 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы.

Более предпочтительно R^8 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 алкилкарбонил, C_1 - C_3 алкилсульфанил, C_1 - C_3 алкилкарбонил, C_1 - C_3 алкилсульфинил, C_1 - C_3 алкилкарбонил, C_1 - C_3 алкилсульфонил, C_1 - C_3 алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома,
30 по отдельности выбранные из азота и кислорода.

Еще более предпочтительно R^8 представляет собой водород или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода.

Еще более предпочтительно R^8 представляет собой водород или
5 тетрагидрофуран-3-карбонил. Наиболее предпочтительно R^8 представляет собой водород.

В соединении формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно:

- 10 А представляет собой C-H или N;
 R^1 представляет собой C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода;
15 R^2 представляет собой водород или фтор;
 R^3 представляет собой метил;
каждый из R^4 , R^5 и R^6 независимо представляет собой водород или метил;
 R^7 представляет собой водород; и
 R^8 представляет собой водород или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный
20 фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода.
Более предпочтительно А представляет собой N;
 R^1 представляет собой C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или
25 гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода;
 R^2 представляет собой водород или фтор;
 R^3 представляет собой метил;
30 каждый из R^4 , R^5 и R^6 независимо представляет собой водород или метил;
 R^7 представляет собой водород; и
 R^8 представляет собой водород или тетрагидрофуранил.
Еще более предпочтительно А представляет собой N;

R^1 представляет собой C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4- или 5-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее один атом кислорода;

5 R^2 представляет собой водород или фтор;

R^3 представляет собой метил;

R^4 представляет собой водород;

R^5 и R^6 одновременно представляют собой метил;

R^7 представляет собой водород; и

10 R^8 представляет собой водород.

В дополнительной группе предпочтительных вариантов осуществления в соединении формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно А представляет собой N;

15 R^1 представляет собой C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфанил C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

R^2 представляет собой водород или фтор;

20 R^3 представляет собой метил;

R^4 представляет собой водород;

R^5 и R^6 одновременно представляют собой метил;

R^7 представляет собой водород; и

R^8 представляет собой водород.

25 Более предпочтительно А представляет собой N;

30 R^1 представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода;

R^2 представляет собой водород или фтор;

R^3 представляет собой метил;

R^4 представляет собой водород;

R^5 и R^6 одновременно представляют собой метил;

R^7 представляет собой водород; и

R^8 представляет собой водород.

Предпочтительно соединение формулы (I) выбрано из следующего:

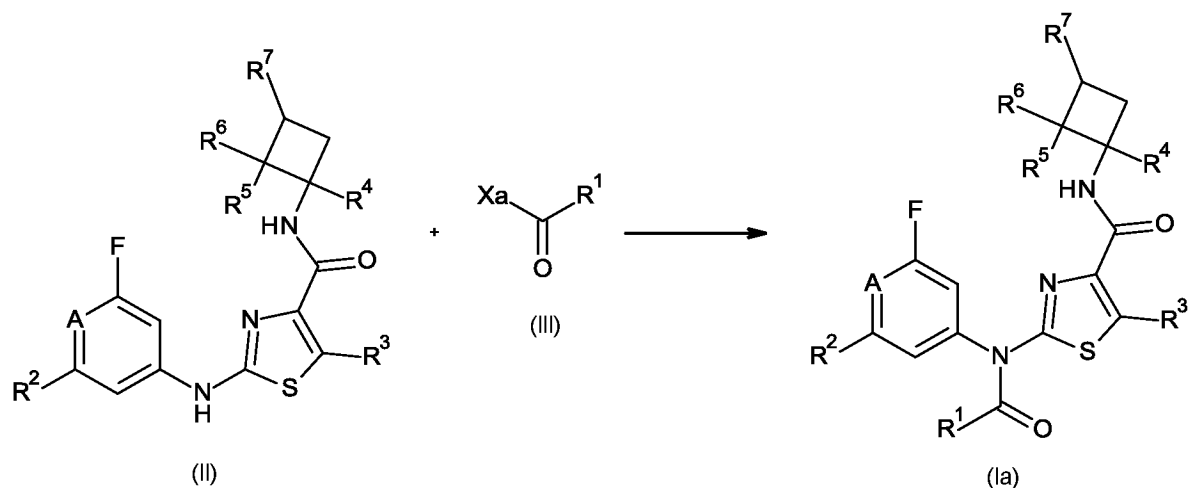
- 5 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагидрофуран-3-карбонил)тиазол-4-карбоксамид (P-1);
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-2-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-2);
- 10 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-3);
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(оксетан-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-4);
2-[2-трет-бутоксипропаноил-(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-
- 15 диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-5);
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(2-изопропоксипропаноил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-6);
2-[(2-трет-бутоксияцетил)-(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-7);
- 20 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(2-изопропоксиацетил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-8);
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(2-метоксипропаноил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-9);
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(2-метилсульфонилпропаноил)амино]-N-(2,2-
- 25 диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-10) и
2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидропиран-4-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (P-11).

Соединения по настоящему изобретению можно получать, как показано на
следующих схемах, на которых, если не указано иное, определение каждой переменной
30 является таким, как определено выше для соединения формулы (I).

Соединения формулы (Ia) в соответствии с настоящим изобретением, где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как определено для формулы (I), и R^8 представляет собой водород, можно получать путем преобразования соединения формулы (II), где A , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как определено для формулы (I), с помощью

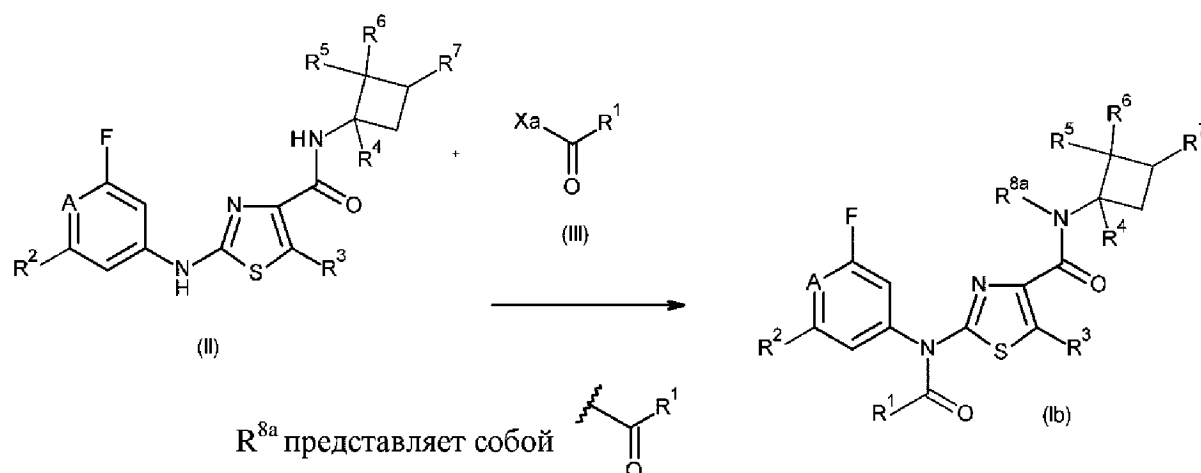
соединения формулы (III), где R^1 является таким, как определено для формулы (I), и Xa представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, либо посредством термического нагревания, либо с помощью основания. Данное показано на схеме 1 (ниже).

5 Схема 1



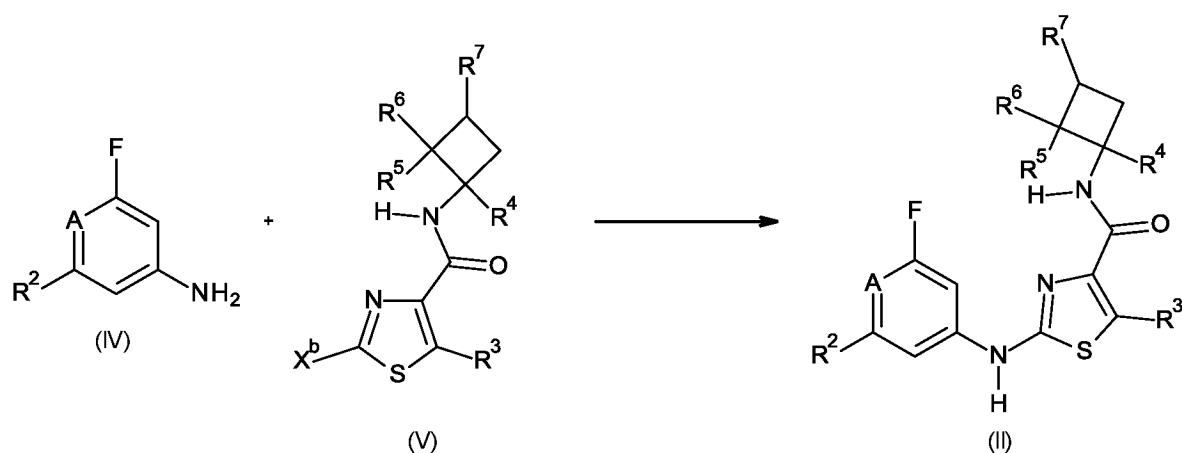
Специалистам в данной области техники будет понятно, что условия, применяемые для получения соединений формулы (Ia), будут зависеть от стехиометрии реакции. Например, осуществление реакции 1-1,5 эквивалентов соединений формулы (III) с 1 эквивалентом соединений формулы (II) приведет к преимущественно соединений формулы (Ia), при этом осуществление реакции 2-2,1 эквивалентов соединений формулы (III) с 1 эквивалентом соединений формулы (II) приведет к получению соединений формулы (Ib), где R^{8a} представляет собой C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклил представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы. Это проиллюстрировано на схеме 2 (ниже).

Схема 2



Соединения формулы (II), где A, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ являются такими, как определено для формулы (I), можно получать путем преобразования соединения формулы (IV), где A или R² являются такими, как определено для формулы (I), с помощью соединения формулы (V), где R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ являются такими, как определено для формулы (I), и X^b представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, либо посредством термического нагревания, либо с помощью основания, либо при условиях катализируемого переходным металлом аминирования по Бухвальду-Хартвигу. Данное показано на схеме 3 (ниже). Такие соединения формулы (II) были описаны в WO 2019/105933.

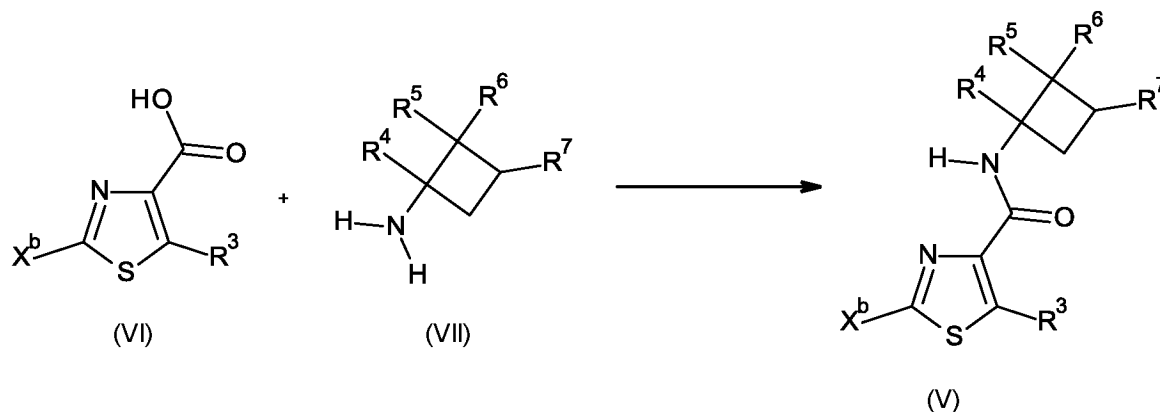
Схема 3



Соединения формулы (V), где R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ являются такими, как определено для формулы (I), и X^b представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, можно получать путем преобразования соединения формулы (VI), где R² является таким, как определено для формулы (I) и X^b представляет собой галоген, предпочтительно бром, и соединения формулы (VII), где R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ являются

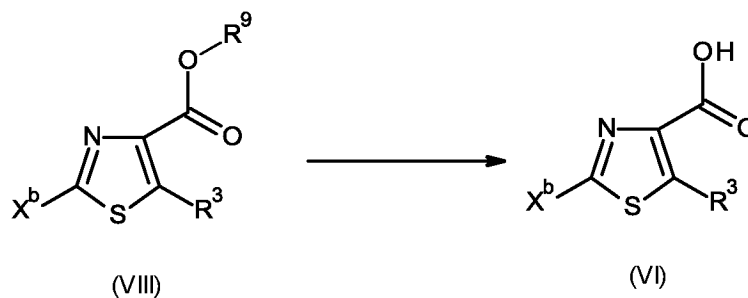
такими, как определено для формулы (I), либо путем применения промежуточного хлорангидрида, либо непосредственно с помощью средства для образования пептидной связи. Данное показано на схеме 4 (ниже).

Схема 4



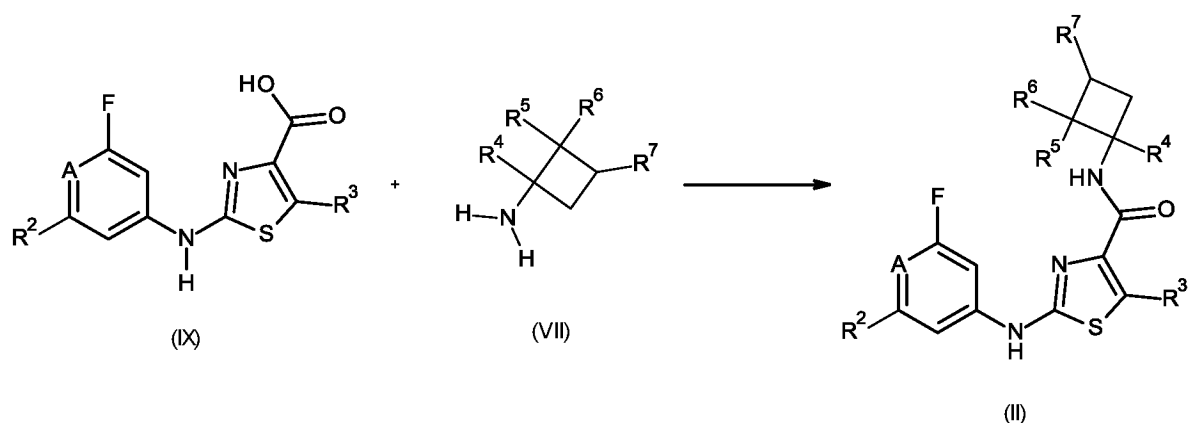
Соединения формулы (VI), где R^3 является таким, как определено для формулы (I), и X^b представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, можно получать путем преобразования соединения формулы (VIII), где R^3 является таким, как определено для формулы (I), X^b представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, и R^9 представляет собой C_1 - C_6 алкил, с помощью основания. Данное показано на схеме 5 (ниже).

Схема 5



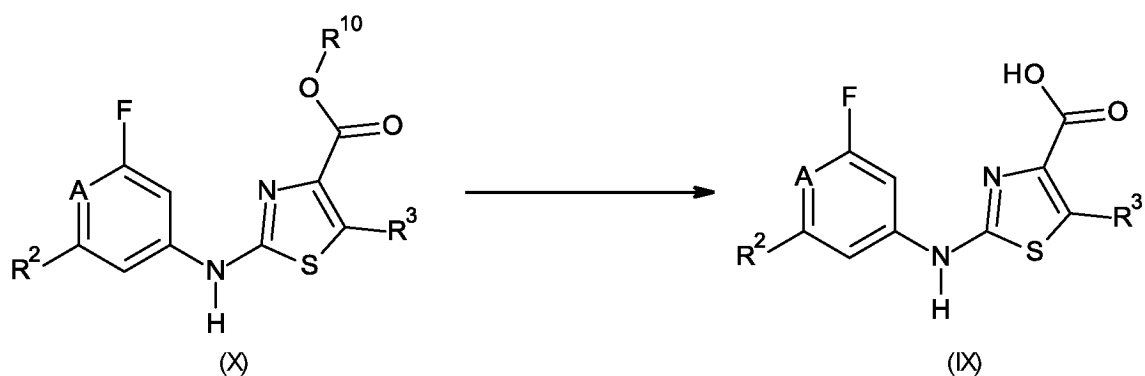
В качестве альтернативы соединения формулы (II), где R^2 и А являются такими, как определено для формулы (I), можно получать путем преобразования соединения формулы (IX), где R^2 , R^3 и А являются такими, как определено для формулы (I), с помощью соединения формулы (VII), где R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как определено для формулы (I), либо посредством применения промежуточного соединения, представляющего собой хлорангидрид, либо непосредственно с помощью средства для образования пептидной связи. Данное показано на схеме 6 (ниже).

Схема 6



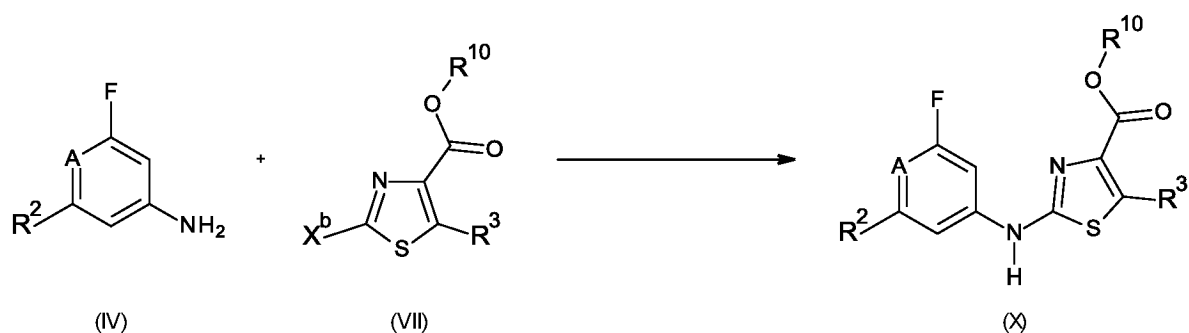
Соединения формулы (IX), где R^2 , A и R^3 являются такими, как определено для формулы (I), можно получать путем преобразования соединения формулы (X), где R^2 , R^3 и A являются такими, как определено для формулы (I), и R^{10} представляет собой C_1 - C_6 алкил, с помощью основания. Данное показано на схеме 7 (ниже).

Схема 7



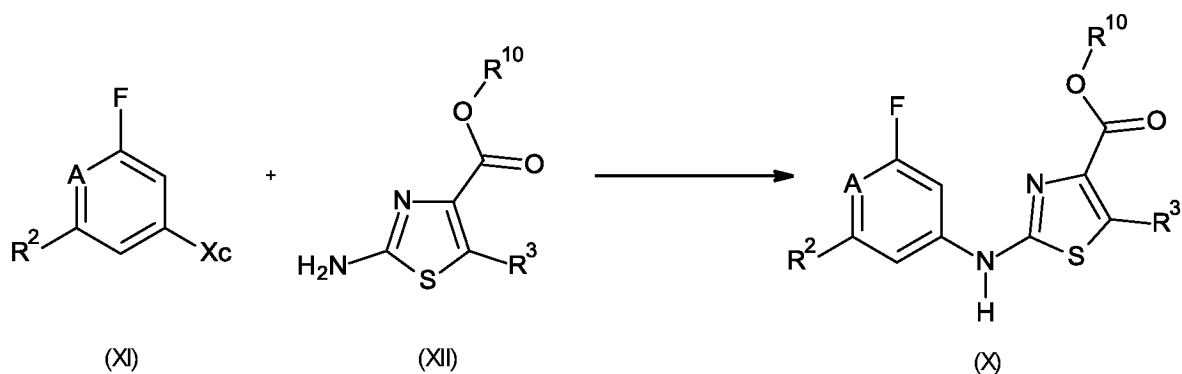
Соединения формулы (X), где R^2 , A и R^3 являются такими, как определено для формулы (I), и R^{10} представляет собой C_1 - C_6 алкил, можно получать путем преобразования соединения формулы (IV), где A и R^2 являются такими, как определено для формулы (I), с помощью соединения формулы (VII), где R^3 является таким, как определено для формулы (I), Xb представляет собой галоген, предпочтительно бром или хлор, и R^{10} представляет собой C_1 - C_6 алкил, либо посредством термического нагревания, либо с помощью основания, либо при условиях катализируемого переходным металлом аминирования по Бухвальду-Хартвику. Данное показано на схеме 8 (ниже).

Схема 8



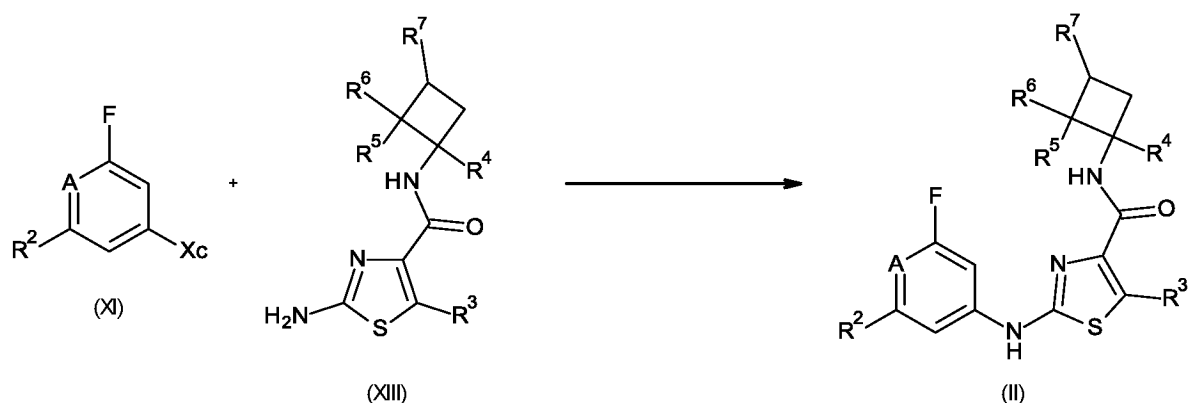
В качестве альтернативы соединения формулы (X), где R^2 , A и R^3 являются такими, как определено для формулы (I), и R^{10} представляет собой C_1 - C_6 алкил, можно получать путем преобразования соединения формулы (XI), где R^2 и A являются такими, как определено для формулы (I), и Xс представляет собой галоген, предпочтительно бром или йод, с помощью соединения формулы (XII), где R^3 является таким, как определено для формулы (I), и R^{10} представляет собой C_1 - C_6 алкил, при условиях катализируемого переходным металлом аминирования по Бухвальду-Хартвигу. Данное

Схема 9



В качестве альтернативы соединения формулы (II), где A, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как определено для формулы (I), можно получать путем преобразования соединения формулы (XI), где A и R^2 являются такими, как определено для формулы (I), и Xс представляет собой галоген, предпочтительно бром или йод, с помощью соединения формулы (XIII), где R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как определено для формулы (I), либо посредством термического нагревания, либо с помощью основания, либо при условиях катализируемого переходным металлом аминирования по Бухвальду-Хартвигу. Данное показано на схеме 10 (ниже).

Схема 10



Неожиданно в данной работе было обнаружено, что новые соединения формулы (I) обладают, для практических целей, весьма эффективным уровнем биологической активности для защиты растений от заболеваний, которые вызваны грибами.

Соединения формулы (I) можно применять в сельском хозяйстве и связанных с ним областях применения, например, в качестве активных ингредиентов для контроля вредителей растений или на неживых материалах для контроля микроорганизмов, вызывающих порчу, или организмов, потенциально вредных для человека. Новые соединения отличаются превосходной активностью при низких нормах применения, при этом они хорошо переносятся растениями и являются безопасными для окружающей среды. Они характеризуются очень полезными лечебными, профилактическими и системными свойствами, и их можно применять для защиты многочисленных культурных растений. Соединения формулы (I) можно применять для подавления или уничтожения вредителей, которые встречаются на растениях или частях растений (плодах, цветках, листьях, стеблях, клубнях, корнях) различных сельскохозяйственных культур, которые являются полезными растениями, при этом защищая заодно те части растений, которые развиваются позже, например, от фитопатогенных микроорганизмов.

Настоящее изобретение дополнительно относится к способу контроля или предупреждения заражения растений, или материала для размножения растений, и/или собранных продовольственных сельскохозяйственных культур, чувствительных к поражению микроорганизмами, посредством обработки растений, или материала для размножения растений, и/или собранных продовольственных сельскохозяйственных культур, где в отношении растений, их частей или места их произрастания применяют эффективное количество соединения формулы (I).

Также соединения формулы (I) можно применять в качестве фунгицида. Термин "фунгицид", используемый в данном документе, означает соединение, с помощью которого осуществляют контроль, модифицирование или предупреждение роста грибов. Термин "фунгицидно эффективное количество" означает количество такого соединения или комбинации таких соединений, которое способно обеспечивать эффект в отношении роста грибов. Контролирующие или модифицирующие эффекты включают все отклонения от естественного развития, такие как уничтожение, торможение развития и т. п., и предупреждение включает барьер или другое защитное образование в растении или на нем для предупреждения грибковой инфекции.

Также соединения формулы (I) можно применять в качестве средств для протравливания с целью обработки материала для размножения растений, например, семени, к примеру плодов, клубней или зерен, или ростков растения (например, риса), для защиты от вызываемых грибами инфекций, а также от встречающихся в почве фитопатогенных грибов. Материал для размножения можно обрабатывать композицией, содержащей соединение формулы (I), перед посадкой: семя, например, можно протравливать перед посевом.

Активные ингредиенты в соответствии с настоящим изобретением также можно применять в отношении зерен (нанесение покрытия), либо пропитывая семена в жидком составе, либо покрывая их твердым составом. Композицию также можно применять в отношении места посадки во время посадки материала для размножения, например, в отношении борозды для семян в ходе посева. Настоящее изобретение также относится к таким способам обработки материала для размножения растений и к материалу для размножения растений, обрабатываемому таким образом.

Более того, соединения в соответствии с настоящим изобретением можно применять для контроля грибов в смежных областях, например, в области защиты технических материалов, в том числе деревянной и относящейся к дереву технической продукции, в области хранения продуктов питания, в области организации санитарной обработки.

Кроме того, настоящее изобретение можно применять для защиты неживых материалов от поражения грибами, например, пиломатериалов, облицовочных плит и краски.

Соединения формулы (I) могут быть, например, эффективными в отношении грибов и переносчиков заболеваний, относящихся к грибам, а также в отношении фитопатогенных бактерий и вирусов. Эти грибы и переносчики заболеваний,

относящиеся к грибам, а также фитопатогенные бактерии и вирусы представляют собой, например:

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

Stagonospora nodorum, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp., в том числе *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. в том числе *V. inaequalis*, *Verticillium* spp, и *Xanthomonas* spp.

5 В объеме настоящего изобретения целевые сельскохозяйственные культуры и/или
полезные растения, подлежащие защите, как правило, включают многолетние и
однолетние культуры, такие как ягодные растения, например, разновидности ежевики,
черники, клюквы, малины и клубники; зерновые, например, ячмень, маис (кукуруза),
просо, разновидности овса, рис, рожь, сорго, тритикале и пшеница; волокнистые
10 растения, например, хлопчатник, лен, конопля, джут и сизаль; полевые
сельскохозяйственные культуры, например, сахарная и кормовая свекла, кофейное
дерево, хмель, горчица, масличный рапс (канола), мак, сахарный тростник,
подсолнечник, чайный куст и табак; фруктовые деревья, например, яблоня, абрикос,
авокадо, банан, вишня, цитрус, нектарин, персик, груша и слива; злаковые травы,
15 например, бермудская трава, мятлик, полевица, эремохлос змеехвостая, овсяница,
плевел, августинова трава и цойсия японская; пряные травы, такие как базилик,
бурачник, шнитт-лук, кориандр, лаванда, любисток, мята, орегано, петрушка, розмарин,
шалфей и тимьян; бобовые, например, разновидности фасоли, чечевицы, гороха и сои;
орехи, например, миндаль, кешью, земляной орех, лещина, арахис, пекан, фисташковое
20 дерево и грецкий орех; пальмы, например, масличная пальма; декоративные растения,
например, цветы, кустарники и деревья; другие деревья, например какао-дерево,
кокосовая пальма, оливковое дерево и каучуковое дерево; овощи, например, спаржа,
баклажан, брокколи, капуста, морковь, огурец, чеснок, салат-латук, кабачок, дыня,
окра, лук репчатый, перец, картофель, тыква, ревень, шпинат и томат; а также
25 виноградные, например, разновидности винограда.

Термин "полезные растения" следует понимать как также включающий полезные
растения, которым придали толерантность к гербицидам, подобным бромоксинулу, или
классам гербицидов (таким как, например, ингибиторы HPPD, ингибиторы ALS,
например, примисульфурон, просульфурон и трифлорисульфурон, ингибиторы EPSPS
30 (5-енол-пировил-шикимат-3-фосфатсинтазы), ингибиторы GS (глутаминсинтазы) или
ингибиторы PPO (протопорфириногенаксидазы)) в результате традиционных способов
селекции или генной инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой
была придана толерантность к имидазолинонам, например имазамоксу, посредством
традиционных способов селекции (мутагенеза), является сурепица Clearfield® (канола).

Примеры сельскохозяйственных культур, которым была придана толерантность к гербицидам или классам гербицидов посредством способов генной инженерии, включают устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под торговыми названиями RoundupReady®, Herculex I® и LibertyLink®.

5 Термин "полезные растения" следует понимать как также включающий полезные растения, которые были трансформированы посредством применения методик с использованием рекомбинантных ДНК таким образом, что они стали способны синтезировать один или несколько токсинов избирательного действия, таких как известные, например, у токсинообразующих бактерий, в особенности бактерий рода
10 *Bacillus*.

Примерами таких растений являются: YieldGard® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry(IA)(b)); YieldGard Rootworm® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIII(b1)); YieldGard Plus® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry(IA)(b) и токсин CryIII(b1)); Starlink® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry9(c)); Herculex
15 I® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIF(a2) и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (ПАТ) для обеспечения толерантности к гербициду глюфосинату аммония); NuCOTN 33B® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry(IA)(c)); Bollgard I® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry(IA)(c)); Bollgard II® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry(IA)(c) и токсин CryI(IA)(b)); VIPCOT®
20 (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин VIP); NewLeaf® (сорт картофеля, экспрессирующий токсин CryII(IA)); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 с признаком толерантности к глифосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 с признаком устойчивости к кукурузному мотыльку (CB)), Agrisure® RW (с признаком устойчивости к западному кукурузному жуку) и Protecta®.

25 Термин "сельскохозяйственные культуры" следует понимать как включающий также культурные растения, которые были трансформированы с помощью методик с применением рекомбинантных ДНК таким образом, что они стали способны синтезировать один или несколько токсинов избирательного действия, таких как известные, например, у токсинообразующих бактерий, в особенности бактерий рода
30 *Bacillus*.

Токсины, которые могут экспрессироваться такими трансгенными растениями, включают, например, инсектицидные белки из *Bacillus cereus* или *Bacillus popilliae*; или инсектицидные белки из *Bacillus thuringiensis*, такие как δ -эндотоксины, например, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 или Cry9C, или

вегетативные инсектицидные белки (Vip), например, Vip1, Vip2, Vip3 или Vip3A; или инсектицидные белки бактерий, колонизирующих нематод, например, *Photorhabdus* spp. или *Xenorhabdus* spp., таких как *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсины, продуцируемые животными, такие как токсины скорпионов, 5 токсины паукообразных, токсины ос и другие специфичные для насекомых нейротоксины; токсины, продуцируемые грибами, такие как токсины *Streptomyces*, растительные лектины, такие как лектины гороха, лектины ячменя или лектины подснежника; агглютинины; ингибиторы протеиназ, такие как ингибиторы трипсина, ингибиторы сериновой протеазы, ингибиторы патаина, цистатина, папаина; белки, 10 инактивирующие рибосому (RIP), такие как рицин, RIP маиса, абрин, люффин, сапорин или бриодин; ферменты метаболизма стероидов, такие как 3-гидроксистероид-оксидаза, экистероид-UDP-гликозилтрансфераза, холестерин-оксидазы, ингибиторы экидона, HMG-CoA-редуктаза, блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых или кальциевых каналов, эстераза ювенильного гормона, рецепторы 15 диуретических гормонов, стильбенсинтаза, дибензилсинтаза, хитиназы и глюканазы.

В контексте настоящего изобретения под δ -эндотоксинами, например Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 или Cry9C, или вегетативными инсектицидными белками (Vip), например Vip1, Vip2, Vip3 или Vip3A, следует 20 понимать явным образом также гибридные токсины, усеченные токсины и модифицированные токсины. Гибридные токсины получают рекомбинантным способом с помощью новой комбинации различных доменов этих белков (см., например, WO 02/15701). Известны усеченные токсины, например, усеченный Cry1Ab. В случае модифицированных токсинов одна или несколько аминокислот токсина, 25 встречающегося в природе, являются замещенными. При таких аминокислотных заменах в токсин предпочтительно вводят не присутствующие в природном токсине последовательности, распознаваемые протеазами, так, например, в случае Cry3A055 в токсин Cry3A вводят последовательность, распознаваемую катепсином G (см. WO 03/018810).

Примеры таких токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать 30 такие токсины, раскрыты, например, в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 и WO 03/052073. Способы получения таких трансгенных растений в целом известны специалисту в данной области и описаны, например, в публикациях, упомянутых выше. Дезоксирибонуклеиновые кислоты CryI-типа и их

получение известны, например, из WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 и WO 90/13651.

Токсин, содержащийся в трансгенных растениях, придает растениям выносливость по отношению к вредным насекомым. Такие насекомые могут принадлежать к любой таксономической группе насекомых, но особенно часто встречаются среди жуков (Coleoptera), двукрылых насекомых (Diptera) и бабочек (Lepidoptera).

Известны трансгенные растения, содержащие один или несколько генов, которые кодируют устойчивость к насекомым и экспрессируют один или несколько токсинов, и некоторые из них коммерчески доступны. Примерами таких растений являются: YieldGard® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry3Bb1); YieldGard Plus® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Ab и токсин Cry3Bb1); Starlink® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry9C); Herculex I® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Fa2 и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) с достижением толерантности к гербициду глюфосинату аммония); NuCOTN 33B® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac); Bollgard I® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac); Bollgard II® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac и токсин Cry2Ab); VipCot® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Vip3A и токсин Cry1Ab); NewLeaf® (сорт картофеля, экспрессирующий токсин Cry3A); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 с признаком толерантности к глифосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 с признаком устойчивости к кукурузному мотыльку (CB)) и Protecta®.

Дополнительными примерами таких трансгенных сельскохозяйственных культур являются следующие.

1. **Маис Bt11** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный *Zea mays*, которому придали устойчивость к поражению кукурузным мотыльком (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) в результате трансгенной экспрессии усеченного токсина Cry1Ab. Маис Bt11 также трансгенно экспрессирует фермент PAT с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.
2. **Маис Bt176** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный *Zea mays*, которому придали устойчивость к поражению кукурузным мотыльком (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) в результате трансгенной экспрессии токсина Cry1Ab.

Маис Bt176 также трансгенно экспрессирует фермент PAT с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

3. **Маис MIR604** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Маис, которому придали
5 устойчивость к насекомым за счет трансгенной экспрессии модифицированного токсина Cry3A. Этот токсин представляет собой Cry3A055, модифицированный путем вставки последовательности, распознаваемой протеазой катепсином G. Получение таких трансгенных растений маиса описано в WO 03/018810.

4. **Маис MON 863** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150
10 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/DE/02/9. MON 863 экспрессирует токсин Cry3Bb1 и обладает устойчивостью к некоторым насекомым из отряда Coleoptera.

5. **Хлопчатник IPC 531** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/ES/96/02.

6. **Маис 1507** от Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Брюссель,
15 Бельгия, регистрационный номер C/NL/00/10. Генетически модифицированный маис для экспрессии белка Cry1F с обеспечением устойчивости к некоторым насекомым из отряда Lepidoptera и белка PAT с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

7. **Маис NK603 × MON 810** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-
20 1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/GB/02/M3/03. Состоит из гибридных сортов маиса, выведенных традиционным способом скрещивания генетически модифицированных сортов NK603 и MON 810. Маис NK603 × MON 810 трансгенно экспрессирует белок CP4 EPSPS, полученный из *Agrobacterium sp.*, штамма CP4, который придает толерантность к гербициду Roundup® (содержит глифосат), а
25 также токсин Cry1Ab, полученный из *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, который обеспечивает толерантность к некоторым представителям отряда Lepidoptera, включая кукурузного мотылька.

Кроме того, на сегодняшний день не наблюдалось перекрестной устойчивости между соединениями формулы (I) (включая любое из соединений, описанных в таблице
30 2 (ниже)) и любыми фунгицидными растворами, применяемыми для обеспечения контроля фитопатогенных грибов в том числе *Absidia corymbifera*, *Alternaria spp*, *Aphanomyces spp*, *Ascochyta spp*, *Aspergillus spp*. в том числе *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium spp*. в том числе *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria spp*. в том числе *B.*

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

pachyrhizi, *Pyricularia oryzae*, *Alternaria solani*, *Alternaria alternata*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Colletotrichum lagenarium*, *Didymella bryoniae*, *Ascochyta pisii*, *Verticillium dahliae*, *Pyrenophora teres*, *Cercospora beticola*, *Ramularia collo-cygni*, *Botrytis cinerea*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Monilinia laxa*, *Monographaella nivalis* и *Venturia inaequalis*.

5 Действительно, в научной литературе сообщалось об устойчивых к фунгицидам штаммах у любого из видов, перечисленных выше, при этом штаммы устойчивы к одному или нескольким фунгицидам из по меньшей мере одного из следующих классов фунгицидов по механизму действия: ингибиторы внешнего хинон-связывающего сайта (QoI), ингибиторы внутреннего хинон-связывающего сайта (QiI), ингибиторы сукцинатдегидрогеназы (SDHI) и ингибиторы деметилирования стероидов (DMI). Такие устойчивые к фунгицидам штаммы могут содержать следующее.

- Мутация в митохондриальном гене цитохрома b, придающая устойчивость к ингибиторам Qo, где мутация представляет собой G143A, F129L или G137R. См. например: Gisi et al., Pest Manag Sci 56, 833-841 (2000), Lucas, Pestic Outlook 14(6), 268-70 (2003), Fraaije et al., Phytopathol 95(8), 933-41 (2005), Sierotzki et al., Pest Manag Sci 63(3), 225-233 (2007), Semar et al., Journal of Plant Diseases and Protection (3), 117-119 (2007); и Pasche et al., Crop Protection 27(3-5), 427-435 (2008).
- Мутация в митохондриальном гене цитохрома b, придающая устойчивость к ингибиторам Qi, где мутация представляет собой G37A/C/D/S/V. См. например: Meunier et al., Pest Manag Sci 2019; 75: 2107-2114.
- Мутация в генах, кодирующих субъединицы SdhB,C,D, придающая устойчивость к ингибиторам SDHI, при этом мутация имеется у следующих основных патогенов:
 - o *Botrytis cinerea*: B-P225H/L/T/Y/F, B-N230I, B-H272L/Y/R, C-P80H/L, C-N87S;
 - o *Alternaria solani*: B-H278R/Y, C-H134R/Q, D-D123E, D-H133R и C-H134R;
 - o *Zymoseptoria tritici*: sdhB: N225T, N225I, R265P, T268I, T268A. B sdhC: T79N, T79I, W80S, W80A, A84F, N86S, N86A, P127A, R151M/S/T/G, R151S, R151T, H152R/Y, V166M, T168R. B sdhD: I50F, M114V, D129G, T20P+K186R;
 - o *Pyrenophora teres*: B sdhB: S66P, N235I, H277Y. B sdhC: K49E, R64K, N75S, G79R, H134R, S135R. B sdhD: D124E, H134R, G138V, D145G;
 - o *Ramularia collo-cygni*: B sdhB: N224T, T267I. B sdhC: N87S, G91R, H146R/L, G171D, H153R;
 - o *Phakopsora pachyrhizi*: C-I86F;

- о *Sclerotinia sclerotiorum*: В sdhB: H273Y. В sdhC: G91R, H146R. В sdhD: T108K, H132R, G150R.

Основным источником информации является www.frac.info, Sierotzki and Scalliet *Phytopathology* (2013) 103(9): 880–887 и Simões et al., *J Plant Dis Prot* (2018) 125: 21-2.

- 5 • Мутация или комбинация мутаций в гене CYP51, придающая устойчивость к ингибиторам DMI, где мутации представляют собой: L50S, D134G, V136A/C, Y137F, S188N, A379G, I381V, делецию 459-460, Y461H/S, N513K, S524T. Основным источником информации является www.frac.info, Cools et al., *Plant Pathol* (2013) 62: 36-42 и Schmitz HK et al., *Pest Manag Sci* (2014) 70: 378-388.

10 Таким образом, в предпочтительном варианте осуществления соединения формулы (I) (в том числе любое из соединений, описанных в таблице 2 (ниже)), или фунгицидные композиции согласно настоящему изобретению, содержащие соединение формулы (I), используют для контроля штаммов грибов, которые являются устойчивыми к одному или нескольким фунгицидам любого из следующих классов
15 фунгицидов: ингибиторы внешнего хинон-связывающего сайта (QoI), ингибиторы внутреннего хинон-связывающего сайта (QiI), ингибиторы сукцинатдегидрогеназы (SDHI) и ингибиторы деметилирования стероидов (DMI).

Термин "место произрастания", используемый в данном документе, означает поля, в которых или на которых выращивают растения, или где высевает семена
20 культивируемых растений, или где семена будут помещать в почву. Он включает почву, семена и проростки, а также имеющиеся зеленые растения.

Термин "растения" относится ко всем физическим частям растения, включая семена, проростки, побеги, корни, клубни, стебли, черешки, листву и плоды.

Термин "материал для размножения растений" понимают как обозначающий
25 генеративные органы растения, такие как семена, которые можно применять для размножения последнего, и вегетативный материал, такой как черенки или клубни, например, картофельные. В данном случае могут быть упомянуты, например, семена (в строгом смысле), корни, плоды, клубни, луковицы, корневища и части растений. Также можно упомянуть проросшие растения и молодые растения, которые следует
30 пересадить после прорастания или после появления из почвы. Эти молодые растения можно защитить до пересадки посредством полной или частичной обработки путем погружения. Предпочтительно "материал для размножения растений" следует понимать как обозначающий семена.

Пестицидные средства, указанные в данном документе с использованием их общепринятых названий, известны, например, из "The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009.

5 Соединения формулы (I) можно применять в немодифицированной форме или, предпочтительно, вместе со вспомогательными веществами, традиционно применяемыми в области составления. Поэтому в целях удобства их можно составлять с помощью известного способа в эмульгируемые концентраты, наносимые в виде покрытия пасты, непосредственно распыляемые или разбавляемые растворы или суспензии, разбавленные эмульсии, смачиваемые порошки, растворимые порошки, 10 пылевидные препараты, грануляты, а также инкапсулированные формы, например, в полимерных веществах. Как и в случае с типом композиций, способы применения, такие как распыление, мелкодисперсное распыление, опыление, рассеивание, нанесение покрытия или полив, выбирают в соответствии с предполагаемыми целями и преобладающими условиями. Композиции также могут содержать дополнительные 15 вспомогательные вещества, такие как стабилизаторы, противовспениватели, регуляторы вязкости, связующие вещества или вещества для повышения клейкости, а также удобрения, доноры микроэлементов или другие составы для получения особых эффектов.

Подходящие носители и вспомогательные вещества, например, для 20 сельскохозяйственного применения, могут быть твердыми или жидкими и представлять собой вещества, пригодные в технологии составления, например, природные или регенерированные минеральные вещества, растворители, диспергирующие вещества, смачивающие вещества, вещества для повышения клейкости, загустители, связующие вещества или удобрения. Такие носители, например, описаны в WO 97/33890.

25 Соединения формулы (I) обычно применяют в форме композиций, и их можно применять по отношению к посевной площади или растению, подлежащему обработке, одновременно или последовательно с дополнительными соединениями. Такие дополнительные соединения могут представлять собой, например, удобрения, или доноры микроэлементов, или другие препараты, которые влияют на рост растений. Они 30 также могут представлять собой селективные гербициды или неселективные гербициды, а также инсектициды, фунгициды, бактерициды, нематоциды, моллюскоциды или смеси из нескольких этих препаратов, при необходимости вместе с дополнительными носителями, поверхностно-активными веществами или

облегчающими применение вспомогательными веществами, обычно используемыми в области составления.

Соединения формулы (I) можно применять в форме (фунгицидных) композиций для контроля или защиты от фитопатогенных микроорганизмов, содержащих в качестве активного ингредиента по меньшей мере одно соединение формулы (I) или по меньшей мере одно предпочтительное отдельное соединение, определенное выше, в свободной форме или в форме агрохимически применимой соли и по меньшей мере одно из приведенных выше вспомогательных веществ.

В настоящем изобретении предусмотрена композиция, предпочтительно фунгицидная композиция, содержащая по меньшей мере одно соединение формулы (I), приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель и необязательно вспомогательное вещество. Приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель представляет собой, например, носитель, который является подходящим для сельскохозяйственного применения. Сельскохозяйственные носители хорошо известны из уровня техники. Предпочтительно указанная композиция может содержать по меньшей мере одно или несколько пестицидно активных соединений, например, дополнительный фунгицидно активный ингредиент в дополнение к соединению формулы (I).

Соединение формулы (I) может быть единственным активным ингредиентом композиции или при необходимости оно может быть смешано с одним или несколькими дополнительными активными ингредиентами, такими как пестицид, фунгицид, синергист, гербицид или регулятор роста растений. Дополнительный активный ингредиент может, в некоторых случаях, приводить к появлению неожиданных синергических видов активности.

Примеры подходящих дополнительных активных ингредиентов включают следующее: фунгициды группы ациклоаминокислоты, фунгициды группы алифатических азотсодержащих соединений, фунгициды группы амидов, фунгициды группы анилидов, фунгициды группы антибиотиков, фунгициды группы ароматических соединений, мышьяксодержащие фунгициды, фунгициды группы арилфенилкетонов, фунгициды группы бензамидов, фунгициды группы бензанилидов, фунгициды группы бензимидазолов, фунгициды группы бензотиазолов, растительные фунгициды, фунгициды группы мостиковых дифенилов, фунгициды группы карбаматов, фунгициды группы карбанилатов, фунгициды группы коназолов, медьсодержащие фунгициды, фунгициды группы дикарбоксимидов, фунгициды

группы динитрофенолов, фунгициды группы дитиокарбаматов, фунгициды группы дитиоланов, фунгициды группы фураимидов, фунгициды группы фуранилидов, фунгициды группы гидразидов, фунгициды группы имидазолов, ртутьсодержащие фунгициды, фунгициды группы морфолинов, фунгициды группы фосфорорганических соединений, фунгициды группы оловоорганических соединений, фунгициды группы оксатионов, фунгициды группы оксазолов, фунгициды группы фенилсульфамидов, фунгициды группы полисульфидов, фунгициды группы пиразолов, фунгициды группы пиридинов, фунгициды группы пиримидинов, фунгициды группы пирролов, фунгициды группы четвертичных аммониевых соединений, фунгициды группы хинолинов, фунгициды группы хинонов, фунгициды группы хиноксалинов, фунгициды группы стробилуринов, фунгициды группы сульфонанилидов, фунгициды группы тиadiaзолов, фунгициды группы тиазолов, фунгициды группы тиазолидинов, фунгициды группы тиокарбаматов, фунгициды группы тioenов, фунгициды группы триазинов, фунгициды группы триазолов, фунгициды группы триазолопиримидинов, фунгициды группы мочевины, фунгициды группы валинамидов и цинксодержащие фунгициды.

Примеры подходящих дополнительных активных ингредиентов также включают следующие: нефтяные масла, 1,1-бис(4-хлорфенил)-2-этоксиэтанол, 2,4-дихлорфенил бензолсульфонат, 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамид, 4-хлорфенил-фенил-сульфон, ацетопрол, альдоксикарб, амидитион, амидотиоат, амитон, амитона гидрооксалат, амитраз, арамит, оксид мышьяка, азобензол, азотоат, беномил, беноксафос, бензилбензоат, биксафен, брофенвалерат, бромоциклен, бромофос, бромопропилат, бупрофезин, бутоксикарбоксим, бутоксикарбоксим, бутилпиридабен, полисульфид кальция, камфехлор, карбанолат, карбофенотион, цимиазол, хинометионат, хлорбензид, хлордимеформ, гидрохлорид хлордимеформа, хлорфенетол, хлорфенсон, хлорфенсульфид, хлоробензилат, хлоромебуформ, хлорометиурон, хлорпропилат, хлортиофос, цинерин I, цинерин II, цинерины, клозантел, кумафос, кротамитон, кротоксифос, куфранеб, циантоат, DCPM, DDT, дефеион, дефеион-O, дефеион-S, деметон-метил, деметон-O, деметон-O-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, дихлорфлуанид, дихлофос, диклифос, диенохлор, димефокс, динекс, динекс-дихлексин, динокап-4, динокап-6, диноктон, динопентон, диносальфон, динотербон, диоксатион, дифенилсульфон, дисульфирам, DNOC, дофенапин, дорамектин, эндотион, эприномектин, этоат-метил, этримфос, феназафлор, оксид фенбутатина, фенотиокарб, фенпирад, фенпироксимат, фенпиразамин, фензон,

фентрифанил, флубензимин, флуциклоксурон, флуенетил, флуорбензид, FMC 1137, форметанат, гидрохлорид форметаната, формпаранат, гамма-НСН, глиодин, галфенпрокс, гексадецилциклопропанкарбоксилат, изокарбофос, жасмолин I, жасмолин II, йодофенфос, линдан, маленобен, мекарбам, мефосфолан, месульфен, метакрифос, метилбромид, метолкарб, мексакарбат, милбемицин-оксим, мипафокс, монокротофос, морфотион, моксидектин, налед, 4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропил)-5-[(6-йод-3-пиридил)метокси]пиридазин-3-он, нифлуридид, никкомицины, нитрилакарб, комплекс нитрилакарба и хлорида цинка 1:1, ометоат, оксидепрофос, оксидисульфотон, pp'-DDT, паратион, перметрин, фенкаптон, фозалон, фосфолан, фосфамидон, полихлортерпены, полинактины, проклонол, промацил, пропоксур, протидатион, протоат, пиретрин I, пиретрин II, пиретрины, пиридафентион, пиримитат, хиналфос, хинтиофос, R-1492, фосглицин, ротенон, шрадан, себуфос, селамектин, софамид, SSI-121, сульфирам, сульфлурамид, сульфотеп, серу, дифловидазин, тау-флювалинат, ТЕРР, тербам, тетрадифон, тетрасул, тиафенокс, тиокарбоксим, тиофанокс, тиометон, тиохинокс, турингиенсин, триамифос, триаратен, триазофос, триазурон, трифенофос, тринактин, ванидотион, ванилипрол, бетоксазин, диоктаноат меди, сульфат меди, цибутрин, дихлон, дихлорофен, эндотал, фентин, гашеную известь, набам, хинокламин, хинонамид, симазин, ацетат трифенилтина, гидроксид трифенилтина, круфомат, пиперазин, тиофанат, хлоралозу, фентион, пиридин-4-амин, стрихнин, 1-гидрокси-1Н-пиридин-2-тион, 4-(хиноксалин-2-иламино)бензолсульфонамид, 8-гидроксихинолинсульфат, бронопол, гидроксид меди, крезол, дипиритион, додицин, фенаминосулф, формальдегид, гидраргафен, касугамицин, гидрат гидрохлорида касугамицина, бис(диметилдитиокарбамат) никеля, нитрапирин, октилинон, оксолиновую кислоту, окситетрациклин, гидроксихинолинсульфат калия, пробеназол, стрептомицин, сесквисульфат стрептомицина, теклофталам, тиомерсал, *Adoxophyes orana* GV, *Agrobacterium radiobacter*, *Amblyseius* spp., *Anagrapa falcifera* NPV, *Anagrus atomus*, *Aphelinus abdominalis*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Autographa californica* NPV, *Bacillus sphaericus* Neide, *Beauveria brongniartii*, *Chrysoperla carnea*, *Cryptolaemus montrouzieri*, *Cydia pomonella* GV, *Dacnusa sibirica*, *Diglyphus isaea*, *Encarsia formosa*, *Eretmocerus eremicus*, *Heterorhabditis bacteriophora* и *H. megidis*, *Hippodamia convergens*, *Leptomastix dactylopii*, *Macrolophus caliginosus*, *Mamestra brassicae* NPV, *Metaphycus helvolus*, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum*, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, *Neodiprion sertifer* NPV и *N. lecontei* NPV, *Orius* spp., *Paecilomyces fumosoroseus*, *Phytoseiulus persimilis*, *Steinernema bibionis*, *Steinernema*

carpocapsae, Steinernema feltiae, Steinernema glaseri, Steinernema riobrave, Steinernema riobravus, Steinernema scapterisci, Steinernema spp., Trichogramma spp., Typhlodromus occidentalis, Verticillium lecanii, афолат, бисазир, бусульфан, диматиф, хемел, хемпу, метепу, метиотепу, метилафолат, морзид, пенфлурон, тепу, тиохемпу, тиотепу, третамин, уредепу, (Е)-дец-5-ен-1-илацетат с (Е)-дец-5-ен-1-олом, (Е)-тридец-4-ен-1-илацетат, (Е)-6-метилгепт-2-ен-4-ол, (Е,З)-тетрадека-4,10-диен-1-илацетат, (З)-додец-7-ен-1-илацетат, (З)-гексадец-11-еналь, (З)-гексадец-11-ен-1-илацетат, (З)-гексадец-13-ен-11-ин-1-илацетат, (З)-эйкоз-13-ен-10-он, (З)-тетрадец-7-ен-1-аль, (З)-тетрадец-9-ен-1-ол, (З)-тетрадец-9-ен-1-илацетат, (7Е,9З)-додека-7,9-диен-1-илацетат, (9З,11Е)-тетрадека-9,11-диен-1-илацетат, (9З,12Е)-тетрадека-9,12-диен-1-илацетат, 14-метилоктадец-1-ен, 4-метилнонан-5-ол с 4-метилнонан-5-оном, альфа-мультистриатин, бревикомин, кодделур, кодлемон, куелур, диспарлур, додец-8-ен-1-илацетат, додец-9-ен-1-илацетат, додека-8,10-диен-1-илацетат, доминикалур, этил-4-метилоктаноат, эвгенол, фронталин, грандлур, грандлур I, грандлур II, грандлур III, грандлур IV, гексалур, ипсдиенол, ипсенол, японилур, линеатин, литлур, луплур, медлур, мегатомовую кислоту, метилэвгенол, мускалур, октадека-2,13-диен-1-илацетат, октадека-3,13-диен-1-илацетат, орфралур, орикталур, острамон, сиглур, сординин, сулкатол, тетрадец-11-ен-1-илацетат, тримедлур, тримедлур А, тримедлур В₁, тримедлур В₂, тримедлур С, транк-колл, 2-(октилтио)этанол, бутопириноксид, бутокси(полипропиленгликоль), дибутиладипат, дибутилфталат, дибутилсукцинат, диэтилтолуамид, диметилкарбат, диметилфталат, этилгександиол, гексамид, метохин-бутил, метилнеодеканамид, оксамат, пикаридин, 1-дихлор-1-нитроэтан, 1,1-дихлор-2,2-бис(4-этилфенил)этан, 1,2-дихлорпропан с 1,3-дихлорпропеном, 1-бром-2-хлорэтан, 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфенил)этилацетат, 2,2-дихлорвинил-2-этилсульфинилэтилметилфосфат, 2-(1,3-дитиолан-2-ил)фенилдиметилкарбамат, 2-(2-бутоксиэтокси)этилтиоцианат, 2-(4,5-диметил-1,3-диоксолан-2-ил)фенилметилкарбамат, 2-(4-хлор-3,5-ксилилокси)этанол, 2-хлорвинилдиэтилфосфат, 2-имидазолидон, 2-изовалерилиндан-1,3-дион, 2-метил(проп-2-инил)аминофенилметилкарбамат, 2-тиоцианатозетиллаурат, 3-бром-1-хлорпроп-1-ен, 3-метил-1-фенилпиразол-5-илдиметилкарбамат, 4-метил(проп-2-инил)амино-3,5-ксилилметилкарбамат, 5,5-диметил-3-оксоциклогекс-1-енилдиметилкарбамат, ацетион, акрилонитрил, альдрин, аллозамидин, алликсикарб, альфа-экдизон, фосфид алюминия, аминокарб, анабазин, атидатион, азаметифос, дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, гексафторсиликат бария, полисульфид бария, бартрин, Bayer 22/190, Bayer 22408, бета-

цифлутрин, бета-циперметрин, биоэтанометрин, биоперметрин, бис(2-хлорэтил)эфир, буру, бромфенвинфос, бром-DDT, буфенкарб, бутакарб, бутатиофос, бутонат, арсенат кальция, цианид кальция, сероуглерод, тетрахлорметан, гидрохлорид картапа, цевадин, хлорбициклен, хлордан, хлордекон, хлороформ, хлорпикрин, хлорфоксим, хлорпразофос, цис-ресметрин, цисметрин, клоцитрин, ацетоарсенит меди, арсенат меди, олеат меди, кумитоат, криолит, CS 708, цианофенфос, цианофос, циклетрин, цитиоат, d-тетраметрин, DAEP, дазомет, декарбофуран, диамидафос, дикаптон, дихлофентион, дикрезил, дицикланил, диелдрин, диэтил-5-метилпиразол-3-илфосфат, дилор, димефлутрин, диметан, диметрин, диметилвинфос, диметилан, динопроп, диносам, диносеб, диофенолан, диоксабензофос, дитикрофос, DSP, экдистерон, EI 1642, EMPC, EPBP, этафос, этиофенкарб, этилформиат, этилендибромид, этилендихлорид, этиленоксид, EXD, фенхлофос, фенетакарб, фенитротиион, феноксакрим, фенпиритрин, фенсульфотион, фентион-этил, флукофурун, фосметилан, фоспират, фостиэтан, фуратиокарб, фуретрин, гуазатин, ацетаты гуазатина, тетрадиокарбонат натрия, галфенпрокс, HCH, HEOD, гептахлор, гетерофос, HHNDN, синильную кислоту, хиквинкарб, IPSP, изазофос, изобензан, изодрин, изофенфос, изолан, изопротиолан, изоксатион, ювенильный гормон I, ювенильный гормон II, ювенильный гормон III, келеван, кинопрен, арсенат свинца, лептофос, лиримфос, литидатион, метилкарбамат м-куменила, фосфид магния, мазидокс, мекарфон, меназон, хлорид ртути, месульфенфос, метам, метам-калий, метам-натрий, метансульфонилфторид, метокротофос, метопрен, метотрин, метоксихлор, метил-изотиоцианат, метилхлороформ, метиленхлорид, метоксadiaзон, мирекс, нафталофос, нафталин, NC-170, никотин, сульфат никотина, нитиазин, норникотин, O-5-дихлор-4-йодфенил-O-этилэтилфосфонотиоат, O,O-диэтил-O-4-метил-2-оксо-2H-хромен-7-илфосфоротиоат, O,O-диэтил-O-6-метил-2-пропилпиримидин-4-илфосфоротиоат, O,O,O',O'-тетрапропилдитиопирофосфат, олеиновую кислоту, пара-дихлорбензол, паратион-метил, пентахлорфенол, пентахлорфениллаурат, PH 60-38, фенкаптон, фоснихлор, фосфин, фоксим-метил, пириметафос, изомеры полихлордициклопентадиена, арсенит калия, тиоцианат калия, прекоцен I, прекоцен II, прекоцен III, примидофос, профлутрин, промекарб, протиофос, пиразофос, пиресметрин, кассию, хиналфос-метил, хинотион, рафоксанид, ресметрин, ротенон, кадетрин, рианию, рианодин, сабадиллу), шрадан, себуфос, SI-0009, тиапронил, арсенит натрия, цианид натрия, фторид натрия, гексафторсиликат натрия, пентахлорфеноксид натрия, селенат натрия, тиоцианат натрия, сулькофурун, сулькофурун-натрий,

сульфурилфторид, сульпрофос, дегтярные масла, тазимкарб, TDE, тебупиримфос, темефос, тераллетрин, тетрахлорэтан, тикрофос, тиоциклам, гидрогеноксалат тиоциклама, тионазин, тиосултап, тиосултап-натрий, тралометрин, трансперметрин, триазамат, трихлорметафос-3, трихлоронат, триметакарб, толпрокарб, трихлопирикарб, трипреп, вератридин, вератрин, ХМС, зетаметрин, фосфид цинка, золапрофос и меперфлутрин, тетраметилфлутрин, бис(трибутилтин)оксид, бромацетамид, фосфат трехвалентного железа, никлосамид-оламин, оксид трибутилтина, пириморф, трифенморф, 1,2-дибром-3-хлорпропан, 1,3-дихлорпропен, 3,4-дихлортетрагидротиофен 1,1-диоксид, 3-(4-хлорфенил)-5-метилроданин, 5-метил-6-тиоксо-1,3,5-тиадиазиран-3-илуксусную кислоту, 6-изопентениламинопурин, бенклотиаз, цитокинины, DCIP, фурфурал, изамидофос, кинетин, композицию на основе *Myrothecium verrucaria*, тетрахлортиофен, ксиленолы, зеатин, этилксантат калия, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, экстракт *Reynoutria sachalinensis*, альфа-хлоргидрин, анту, карбонат бария, бистиосеми, бродифакум, бромадиолон, брометалин, хлорофацинон, холекальциферол, кумахлор, кумафурил, куматетралил, кримидин, дифенакум, дифетиалон, дифацинон, эргокальциферол, флокумафен, флуороацетамид, флупропадин, гидрохлорид флупропадина, норбормид, фосацетим, фосфор, пиндон, пиринурон, скиллизозид, фторацетат натрия, сульфат таллия, варфарин, 2-(2-бутоксизтокси)этилпиперонилат, 5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-гексилциклогекс-2-енон, фарнесол с неролидом, вербутин, MGK 264, пиперонилбутоксид, пипротал, изомер пропила, S421, сезамекс, сезасмолин, сульфоксид, антрахинон, нафтенат меди, оксихлорид меди, дициклопентадиен, тирам, нафтенат цинка, цирам, иманин, рибавирин, оксид ртути, тиофанат-метил, азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол, эпоксиконазол, фенбуконазол, флухинконазол, флузилазол, флутриафол, фураметпир, гексаконазол, имазалил, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, протиоконазол, пирифенокс, прохлораз, пропиконазол, пиризоксазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, трифлумизол, тритиконазол, анцимидол, фенаримол, нуаримол, бупиримат, диметиримол, этиримол, додеморф, фенпропидин, фенпропиморф, спироксамин, тридеморф, ципродинил, мепанипирим, пириметанил, фенпиклонил, флудиоксонил, беналаксил, фуралаксил, металаксил, R-металаксил, офурас, оксидиксил, карбендазим, дебакарб, фуберидазол, тиабендазол, хлостолинат, дихлостолин, миклозолин, процимидон, винклозолин, боскалид, карбоксин, фенфурам, флутоланил, мепронил, оксикарбоксин, пентиопирад,

тифлузамид, додин, иминоктадин, азоксистробин, димоксистробин, энестробурин, фенаминстробин, флуфеноксистробин, флуоксастробин, крезоксим-метил, метоминостробин, трифлуксистробин, орисастробин, пикоксистробин, пиракlostробин, пираметостробин, пираоксистробин, фербам, манкозеб, манеб, метирам, пропинеб, цинеб, каптафол, каптан, фтороимид, фолпет, толилфлуанид, бордосская смесь, оксид меди, манкоппер, оксиновая медь, нитротал-изопропил, эдифенфос, ипробенфос, фосдифен, толклофос-метил, анилазин, бентиаваликарб, бластицидин-S, хлоронеб, хлороталонил, цифлуфенамид, цимоксанил, циклобутрифлурам, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, диметоморф, флуморф, дитианон, этабоксам, этридиазол, фамоксадон, фенамидон, феноксанил, феримзон, флуазилам, флуметилсульфурим, флуопиколоид, флуокситиоконазол, флусульфамид, флуксапироксад, фенгексамид, фосетил-алюминий, химексазол, ипроваликарб, циазофамид, метасульфоккарб, метрафенон, пенцикурон, фталид, полиоксины, пропамокарб, пирибенкарб, проквиназид, пироквилон, пириофенон, квиноксифен, квинтозен, тиадинил, триазоксид, трициклазол, трифорин, валидамицин, валифеналат, зоксамид, мандипропамид, флubenетерам, изопиразам, седаксан, бензовиндифлупир, пидифлуметофен, 3-дифторметил-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоновую кислоту (3',4',5'-трифтор-бифенил-2-ил)-амид, изофлуципрам, изотианил, дипиметитрон, 6-этил-5,7-диоксо-пирроло[4,5][1,4]дитиино[1,2-с]изотиазол-3-карбонитрил, 2-(дифторметил)-N-[3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид, 4-(2,6-дифторфенил)-6-метил-5-фенил-пиридазин-3-карбонитрил, (R)-3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметилиндан-4-ил]пиразол-4-карбоксамид, 4-(2-бром-4-фтор-фенил)-N-(2-хлор-6-фтор-фенил)-2,5-диметил-пиразол-3-амин, 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, флуиндапир, куметоксистробин (цзясянцзюньчжи), люйбэньмисяньань, дихлобентиазокс, мандестробин, 3-(4,4-дифтор-3,4-дигидро-3,3-диметилизохинолин-1-ил)хинолон, 2-[2-фтор-6-[(8-фтор-2-метил-3-хинолил)окси]фенил]пропан-2-ол, оксатиапипролин, трет-бутил-N-[6-[[[(1-метилтетразол-5-ил)-фенил-метилен]амино]оксиметил]-2-пиридил]карбамат, пиразифлумид, инпирфлуксам, тролпрокарб, мефентрифлуконазол, ипфентрифлуконазол, 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид, N'-(2,5-диметил-4-фенокси-фенил)-N-этил-N-метил-формамидин, N'-[4-(4,5-дихлортиазол-2-ил)окси-2,5-диметил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидин, [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-бис(дифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]тиазол-4-ил]-4,5-дигидроизоксазол-5-ил]-3-хлор-фенил] метансульфонат,

бут-3-инил N-[6-[(Z)-[(1-метилтетразол-5-ил)-фенил-метиле]амино]оксиметил]-2-
 пиридил]карбамат, метил N-[[5-[4-(2,4-диметилфенил)триазол-2-ил]-2-метил-
 фенил]метил]карбамат, 3-хлор-6-метил-5-фенил-4-(2,4,6-трифторфенил)пиридазин,
 пиридахлометил, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметилиндан-4-ил]пиразол-4-
 5 карбоксамид, 1-[2-[[1-(4-хлорфенил)пиразол-3-ил]оксиметил]-3-метил-фенил]-4-метил-
 тетразол-5-он, 1-метил-4-[3-метил-2-[[2-метил-4-(3,4,5-триметилпиразол-1-
 ил)фенокси]метил]фенил]тетразол-5-он, аминопирифен, аметоктрадин, амисулбром,
 пенфлуфен, (Z,2E)-5-[1-(4-хлорфенил)пиразол-3-ил]окси-2-метоксиимино-N,3-диметил-
 пент-3-енамид, флорилпикоксамид, фенпикоксамид, метарилпикоксамид, тебуфлоквин,
 10 ипфлуфеноквин, квинофумелин, изофетамид, N-[2-[2,4-дихлор-фенокси]фенил]-3-
 (дифторметил)-1-метил-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-[2-хлор-4-
 (трифторметил)фенокси]фенил]-3-(дифторметил)-1-метил-пиразол-4-карбоксамид,
 бензотиостробин, фенамакрил, цинковую соль 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиола (2:1),
 флуопирам, флуфеноксадиазам, флутианил, флуопимомид, пирапропон,
 15 пикарбутразокс, 2-(дифторметил)-N-(3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил)пиридин-3-
 карбоксамид, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1, 1, 3-триметилиндан-4-ил)пиридин-3-
 карбоксамид, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-
 ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил, метилтетрапрол, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1,
 1, 3-триметилиндан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид, α-(1, 1-диметилэтил)-α-[4'-
 20 (трифторметокси)[1, 1'-бифенил]-4-ил]-5-пиримидинметанол, флуоксапипролин,
 энноксастробин, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-
 ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-
 гидрокси-3-(5-сульфанил-1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил, 4-
 [[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(5-тиоксо-4Н-1,2,4-триазол-1-
 25 ил)пропил]-3 пиридил]окси]бензонитрил, тринексапак, кумоксистробин,
 чжуншенмицин, тиодиазол меди, тиазол цинка, амектотрактин, ипродион,
 себоктиламин, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1S)-1-метил-2-пропокси-этокси]-3-пиридил]-N-
 этил-N-метил-формаидин, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1R)-1-метил-2-пропокси-этокси]-3-
 пиридил]-N-этил-N-метил-формаидин, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-
 30 этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаидин, N'-[5-хлор-2-метил-6-(1-метил-2-
 пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаидин, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-
 метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-изопропил-N-метил-формаидин (эти
 соединения можно получать из способов, описанных в WO 2015/155075); N'-[5-бром-2-
 метил-6-(2-пропоксиргорокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаидин (данное

соединение можно получать из способов, описанных в IPCOM000249876D); N-изопропил-N'-[5-метокси-2-метил-4-(2,2,2-трифтор-1-гидрокси-1-фенил-этил)фенил]-N-метил-формамидин, N'-[4-(1-циклопропил-2,2,2-трифтор-1-гидрокси-этил)-5-метокси-2-метил-фенил]-N-изопропил-N-метил-формамидин (эти соединения можно получать из

5 способов, описанных в WO 2018/228896); N-этил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)оксетан-2-ил]фенил]-N-метил-формамидин, N-этил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)тетрагидрофуран-2-ил]фенил]-N-метил-формамидин (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2019/110427); N-[(1R)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-енил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1S)-1-бензил-

10 3-хлор-1-метил-бут-3-енил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1R)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1S)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метил-пропил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-7,8-дифтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-7,8-дифтор-хинолин-3-карбоксамид, 8-фтор-N-[(1R)-1-[(3-фторфенил)метил]-

15 1,3-диметил-бутил]хинолин-3-карбоксамид, 8-фтор-N-[(1S)-1-[(3-фторфенил)метил]-1,3-диметил-бутил]хинолин-3-карбоксамид, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметил-бутил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1R)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-енил]-8-фтор-хинолин-3-карбоксамид, N-[(1S)-1-бензил-3-хлор-1-метил-бут-3-енил]-8-фтор-хинолин-3-

20 карбоксамид (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2017/153380); 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-изохинолин, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4,6-трифтор-3,3-диметил-изохинолин, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(6-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолин, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(7-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-

25 ил)изохинолин, 1-(6-хлор-7-метил-пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолин (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2017/025510); 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметил-изохинолин, 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-изохинолин, 6-хлор-4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолин, 4,4-дифтор-1-

30 (5-фтор-4-метил-бензимидазол-1-ил)-3,3-диметил-изохинолин, 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-1-изохинолил)-7,8-дигидро-6H-циклопента[е]бензимидазол (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2016/156085); N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]циклопропанкарбоксамид, N,2-диметокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамид,

N-этил-2-метил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамид, 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевина, 1,3-диметокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевина, 3-этил-1-метокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевина, N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамид, 4,4-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-он, 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-он, этил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пиразол-4-карбоксилат, N,N-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]-1,2,4-триазол-3-амин (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2017/055473, WO 2017/055469, WO 2017/093348 или WO 2017/118689); 2-[6-(4-хлорфеноксид)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2017/029179); 2-[6-(4-бромфеноксид)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2017/029179); 3-[2-(1-хлорциклопропил)-3-(2-фторфенил)-2-гидрокси-пропил]имидазол-4-карбонитрил (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2016/156290); 3-[2-(1-хлорциклопропил)-3-(3-хлор-2-фтор-фенил)-2-гидрокси-пропил]имидазол-4-карбонитрил (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2016/156290); (4-феноксифенил)метил-2-амино-6-метил-пиридин-3-карбоксилат (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2014/006945); 2,6-диметил-1H,5H-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2H,6H)-тетрон (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2011/138281)-N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензолкарботиоамид; N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамид; (Z,2E)-5-[1-(2,4-дихлорфенил)пиразол-3-ил]окси-2-метоксиимино-N,3-диметил-пент-3-енамид (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2018/153707); N'-(2-хлор-5-метил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метил-формамидин; N'-[2-хлор-4-(2-фторфеноксид)-5-метил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидин (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2016/202742); 2-(дифторметил)-N-[(3S)-3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2014/095675); (5-метил-2-пиридил)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метанон, (3-метилизоксазол-5-ил)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-

оксадиазол-3-ил]фенил]метанон (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2017/220485); 2-оксо-N-пропил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]ацетамид (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2018/065414); этил-1-[[5-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]-2-тиенил]метил]пиразол-4-карбоксилат (данное соединение можно получать из способов, описанных в WO 2018/158365); 2,2-дифтор-N-метил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]ацетамид, N-[(E)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамид, N-[(Z)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамид, N-[N-метокси-C-метил-карбонимидаил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамид (такие соединения можно получать из способов, описанных в WO 2018/202428).

Соединения в соответствии с настоящим изобретением также можно применять в комбинации с антигельминтными средствами. Такие антигельминтные средства включают соединения, выбранные из класса соединений макроциклических лактонов, таких как производные ивермектина, авермектина, абамектина, эмамектина, эприномектина, дорамектина, селамектина, моксидектина, немадектина и милбемицина, описанные в EP-357460, EP-444964 и EP-594291. Дополнительные антигельминтные средства включают полусинтетические и биосинтетические производные авермектина/милбемицина, такие как описанные в US-5015630, WO-9415944 и WO-9522552. Дополнительные антигельминтные средства включают бензимидазолы, такие как албендазол, камбендазол, фенбендазол, флубендазол, мебендазол, оксфендазол, оксibenдазол, парбендазол и другие члены этого класса. Дополнительные антигельминтные средства включают имидазотиазолы и тетрагидропиримидины, такие как тетрализол, левамизол, пирантел памоат, оксантел или морантел. Дополнительные антигельминтные средства включают флукициды, такие как триклабендазол и клорсулон, а также цестодоциды, такие как празиквантел и эспипрантел.

Соединения по настоящему изобретению можно применять в комбинации с производными и аналогами класса антигельминтных средств на основе парагеркванида/маркфортина, а также с противопаразитарными оксазолинами, такими как раскрыты в US-5478855, US-4639771 и DE-19520936.

Соединения по настоящему изобретению можно применять в комбинации с производными и аналогами общего класса диоксоморфолиновых противопаразитарных средств, описанными в WO-9615121, а также с антигельминтными активными

циклическими депсипептидами, такими как описаны в WO-9611945, WO-9319053, WO-9325543, EP-626375, EP-382173, WO-9419334, EP-382173 и EP-503538.

Соединения по настоящему изобретению можно применять в комбинации с другими эктопаразитами; например, фипронилом; пиретроидами; фосфорорганическими соединениями; регуляторами роста насекомых, такими как люфенурон; агонистами экдизона, такими как тебуфенозид и т. п.; неоникотиноидами, такими как имидаклоприд и т. п.

Соединения по настоящему изобретению можно применять в комбинации с терпеновыми алкалоидами, описанными, например, в WO 95/19363 или WO 04/72086, в частности соединениями, раскрытыми в этих документах.

Другие примеры таких биологически активных соединений, в комбинации с которыми можно применять соединения по настоящему изобретению, включают без ограничения следующие. Фосфорорганические соединения: ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, бромфос, бромфос-этил, кадусафос, хлорэтоксифос, хлорпирифос, хлорфенвинфос, хлормефос, деметон, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, диалифос, диазинон, дихлорвос, дикротофос, диметоат, дисульфотон, этион, этопрофос, этримфос, фамфур, фенамифос, фенитротрион, фенсульфотион, фентион, флупиразофос, фонофос, формотион, фостиазат, гептенофос, исазофос, изотиоат, изоксатион, малатион, метакрифос, метамидофос, метидатион, метилпаратион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, параоксон, паратион, паратион-метил, фентоат, фозалон, фосфолан, фосфокарб, фосмет, фосфамидон, форат, фоксим, пиримифос, пиримифос-метил, профенофос, пропафос, проэтамфос, протиофос, пираклофос, пиридапентион, квиналфос, сульпрофос, темефос, тербуфос, тебупиримфос, тетрахлорвинфос, тиметон, тиазофос, трихлорфон, вимидотион.

Карбаматы: аланикарб, альдикарб, 2-втор-бутилфенилметилкарбамат, бенфуракарб, карбарил, карбофуран, карбосульфат, клоетокарб, этиофенкарб, феноксикарб, фентиокарб, фуратиокарб, HCN-801, изопрокарб, индоксикарб, метиокарб, метомил, 5-метил-м-куменилбутирил(метил)карбамат, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, UC-51717.

Пиретроиды: акринатрин, аллетрин, альфаметрин, 5-бензил-3-фурилметил-(E)-(1R)-цис-2,2-диметил-3-(2-оксотиолан-3-илиденметил)циклопропанкарбоксилат, бифентрин, бета-цифлутрин, цифлутрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, биоаллетрин, биоаллетрин-((S)-циклопентилизомер), биоресметрин, бифентрин, NCI-

85193, циклопротрин, цигалотрин, цититрин, цифенотрин, дельтаметрин, эмпентрин, эсфенвалерат, этофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, флювалинат (D-изомер), имипротрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, перметрин, фенотрин, праллетрин, пиретрины (натуральные продукты), ресметрин, 5 тетраметрин, трансфлутрин, тета-циперметрин, силафлуофен, тау-флювалинат, тефлутрин, тралометрин, зета-циперметрин.

Регуляторы роста членистоногих: а) ингибиторы синтеза хитина: соединения бензоилмочевины: хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, тефлубензурон, трифлумурон, 10 бупрофезин, диофенолан, гекситиазокс, этоксазол, хлорфентазин; б) антагонисты экдизона: галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид; с) ювеноиды: пирипроксифен, метопрен (включая S-метопрен), феноксикарб; d) ингибиторы биосинтеза липидов: спироциклофен.

Другие противопаразитарные средства: ацеквиноцил, амитраз, AKD-1022, ANS- 15 118, азадирахтин, *Bacillus thuringiensis*, бенсултап, бифеназат, бинапакрил, бромпропилат, BTG-504, BTG-505, камфехлор, картап, хлорбензилат, хлордимеформ, хлорфенапир, хромафенозид, клотианидин, циромазин, диаклоден, диафентиурон, DBI-3204, динактин, дигидроксиметилдигидроксипирролидин, динобутон, динокап, эндосульфат, этипрол, этофенпрокс, феназаквин, флумит, МТИ-800, фенпироксимат, 20 флуакрипирим, флубензимин, флуброцитринат, флуфензин, флуфенпрокс, флупроксифен, галофенпрокс, гидраметилнон, IKI-220, канемит, NC-196, ним гард, нидинортерфуран, нитенпирам, SD-35651, WL-108477, пиридарил, пропаргит, протрифенбут, пиметрозин, пиридабен, пиримидифен, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, силафлуофен, силомадин, спиносад, 25 тебуфенпирад, тетрадифон, тетранактин, тиаклоприд, тиоциклам, тиаметоксам, толфенпирад, триазамат, триэтоксиспиносин, тринактин, вербутин, верталек, YI-5301.

Биологические средства: дельта-эндотоксин *Bacillus thuringiensis* ssp. *aizawai*, *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis*, бакуловирус, энтомопатогенные бактерии, вирусы и грибы.

30 Бактерициды: хлортетрациклин, окситетрациклин, стрептомицин.

Другие биологические средства: энрофлоксацин, фебантел, пенетамат, моноксикам, цефалексин, канамицин, пимобендан, кленбутерол, омепразол, тиамулин, беназеприл, пирипрол, цефквином, флорфеникол, бусерелин, цефовецин, тулатромицин, цефтиофур, карпрофен, метафлумизон, празикварантел, триклабендазол.

Другой аспект настоящего изобретения относится к применению соединения формулы (I) или предпочтительного отдельного соединения, определенного выше, композиции, содержащей по меньшей мере одно соединение формулы (I) или по меньшей мере одно предпочтительное отдельное соединение, определенное выше, или

5 фунгицидной или инсектицидной смеси, содержащей по меньшей мере одно соединение формулы (I) или по меньшей мере одно предпочтительное отдельное соединение, определенное выше, в смеси с другими фунгицидами или инсектицидами, описанными выше, для контроля или предупреждения заражения растений, например

10 полезных растений, таких как сельскохозяйственные культуры, материала для их размножения, например семян, собранных культур, например собранных продовольственных культур, или неживых материалов насекомыми или фитопатогенными микроорганизмами, предпочтительно организмами, являющимися грибами.

Дополнительный аспект настоящего изобретения относится к способу контроля

15 или предупреждения заражения растений, например полезных растений, таких как сельскохозяйственные культуры, материала для их размножения, например семян, собранных культур, например собранных продовольственных культур, или неживых материалов насекомыми, или фитопатогенными или вызывающими порчу

20 микроорганизмами, или организмами, потенциально вредными для человека, особенно организмами, являющимися грибами, который включает применение соединения формулы (I) или предпочтительного отдельного соединения, определенного выше, в качестве активного ингредиента в отношении растений, частей растений или их места произрастания, в отношении материала для их размножения или в отношении любой

части неживых материалов.

25 Контроль или предупреждение означают уменьшение степени заражения насекомыми, или фитопатогенными или вызывающими порчу микроорганизмами, или организмами, потенциально вредными для человека, особенно организмами, являющимися грибами, до такого уровня, чтобы было видно улучшение.

Предпочтительным способом контроля или предупреждения заражения

30 сельскохозяйственных культур фитопатогенными микроорганизмами, особенно организмами, являющимися грибами, или насекомыми, который включает применение соединения формулы (I) или агрохимической композиции, содержащей по меньшей мере одно из указанных соединений, является внекорневое применение. Частота применения и норма применения будут зависеть от риска заражения соответствующим

патогеном или насекомым. Тем не менее, соединения формулы (I) могут также проникать в растение из почвы через корни (системное действие) посредством орошения места произрастания растения жидким составом или посредством применения соединений в твердой форме в отношении почвы, например, в гранулированной форме (внесение в почву). В случае культур водяного риса такие грануляты можно применять в отношении залитого рисового поля. Соединения формулы (I) можно также применять в отношении семян (нанесение покрытия) посредством пропитки семян или клубней либо жидким составом фунгицида, либо посредством покрытия их твердым составом.

Состав, например композицию, содержащую соединение формулы (I) и, при необходимости, твердое или жидкое вспомогательное вещество или мономеры для инкапсулирования соединения формулы (I), можно получать известным способом, как правило, путем тщательного перемешивания и/или измельчения соединения с наполнителями, например растворителями, твердыми носителями и необязательно поверхностно-активными соединениями (поверхностно-активными веществами).

Преимущественные нормы внесения обычно составляют от 5 г до 2 кг активного ингредиента (а. и.) на гектар (га), предпочтительно от 10 г до 1 кг а. и./га, наиболее предпочтительно от 20 г до 600 г а. и./га. В случае применения в качестве средства для пропитки семян подходящие дозировки составляют от 10 мг до 1 г активного вещества на кг семян.

Если комбинации по настоящему изобретению применяют для обработки семян, то достаточными, как правило, являются нормы, составляющие от 0,001 до 50 г соединения формулы (I) на кг семян, предпочтительно от 0,01 до 10 г на кг семян.

Композиции по настоящему изобретению можно использовать в любой традиционной форме, например, в форме сдвоенной упаковки, порошка для сухой обработки семян (DS), эмульсии для обработки семян (ES), текучего концентрата для обработки семян (FS), раствора для обработки семян (LS), диспергируемого в воде порошка для обработки семян (WS), капсульной суспензии для обработки семян (CF), геля для обработки семян (GF), концентрата эмульсии (EC), концентрата суспензии (SC), суспензии эмульсии (SE), капсульной суспензии (CS), диспергируемых в воде гранул (WG), эмульгируемых гранул (EG), эмульсии типа "вода в масле" (EO), эмульсии типа "масло в воде" (EW), микроэмульсии (ME), масляной дисперсии (OD), смешиваемого с маслом текучего вещества (OF), смешиваемой с маслом жидкости (OL), растворимого концентрата (SL), суспензии ультрамалого объема (SU), жидкости ультрамалого

объема (UL), технического концентрата (TK), диспергируемого концентрата (DC), смачиваемого порошка (WP) или любого технически реализуемого состава в сочетании с приемлемыми с точки зрения сельского хозяйства вспомогательными веществами.

Такие композиции могут быть получены традиционным способом, например, путем смешивания активных ингредиентов с соответствующими инертными компонентами состава (разбавителями, растворителями, наполнителями и необязательно другими ингредиентами состава, такими как поверхностно-активные вещества, биоциды, добавки, предохраняющие от замерзания, клейкие вещества, загустители и соединения, которые обеспечивают вспомогательные эффекты). Если необходимо длительное действие, то можно применять также традиционные составы медленного высвобождения. В частности, составы, применяемые в распыленном виде, такие как диспергируемые в воде концентраты (например, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO и т. п.), смачиваемые порошки и гранулы, могут содержать поверхностно-активные вещества, такие как смачивающие и диспергирующие средства и другие соединения, которые обеспечивают вспомогательные эффекты, например, продукт конденсации формальдегида с нафталинсульфонатом, алкиларилсульфонат, лигнинсульфонат, алкилсульфат жирной кислоты и этоксилированный алкилфенол, и этоксилированный жирный спирт.

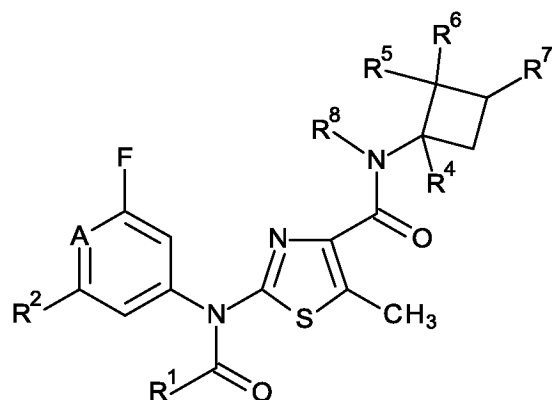
Состав для протравливания семян применяют способом, известным per se для семян, с использованием комбинации по настоящему изобретению и разбавителя в приемлемой форме состава для протравливания семян, например, в виде водной суспензии или в форме сухого порошка, характеризующихся хорошим прилипанием к семенам. Такие составы для протравливания семян известны из уровня техники. Составы для протравливания семян могут содержать отдельные активные ингредиенты или комбинацию активных ингредиентов в инкапсулированной форме, например, в виде капсул или микрокапсул медленного высвобождения.

Как правило, составы содержат от 0,01 до 90% по весу активного средства, от 0 до 20% приемлемого с точки зрения сельского хозяйства поверхностно-активного вещества и от 10 до 99,99% твердых или жидких инертных компонентов состава и вспомогательного(вспомогательных) вещества(веществ), при этом активное средство состоит из по меньшей мере соединения формулы (I) вместе с компонентом (B) и (C) и необязательно других активных средств, в частности, микробиоцидов, или консервантов, или т. п. Концентрированные формы композиций, как правило, содержат приблизительно от 2 до 80%, предпочтительно приблизительно от 5 до 70% по весу

активного средства. Применяемые формы состава могут, например, содержать от 0,01 до 20% по весу, предпочтительно от 0,01 до 5% по весу активного средства. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно будут составлены в виде концентратов, конечный потребитель будет обычно использовать разбавленные составы.

5 В таблице 1 ниже проиллюстрированы примеры отдельных соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением.

В таблице A-1 представлены 48 соединений от A-1.001 до A-1.048 формулы (Ib),



(Ib),

10 где A представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

Таблица 1. Отдельные соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением

№ соединения	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁸
001	водород	водород	водород	водород
002	водород	метил	водород	водород
003	водород	водород	метил	водород
004	водород	метил	метил	водород
005	метил	водород	водород	водород
006	метил	метил	водород	водород
007	метил	водород	метил	водород
008	метил	метил	метил	водород
009	этил	водород	водород	водород
010	этил	метил	водород	водород
011	этил	водород	метил	водород
012	этил	метил	метил	водород
013	водород	водород	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
014	водород	метил	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
015	водород	водород	метил	тетрагидрофуран-3-

				карбонил
016	водород	метил	метил	тетрагидрофуран-3-карбонил
017	метил	водород	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
018	метил	метил	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
019	метил	водород	метил	тетрагидрофуран-3-карбонил
020	метил	метил	метил	тетрагидрофуран-3-карбонил
021	этил	водород	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
022	этил	метил	водород	тетрагидрофуран-3-карбонил
023	этил	водород	метил	тетрагидрофуран-3-карбонил
024	этил	метил	метил	тетрагидрофуран-3-карбонил
025	водород	водород	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
026	водород	метил	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
027	водород	водород	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
028	водород	метил	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
029	метил	водород	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
030	метил	метил	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
031	метил	водород	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
032	метил	метил	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
033	этил	водород	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
034	этил	метил	водород	тетрагидрофуран-2-карбонил
035	этил	водород	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
036	этил	метил	метил	тетрагидрофуран-2-карбонил
037	водород	водород	водород	оксетан-3-карбонил
038	водород	метил	водород	оксетан-3-карбонил
039	водород	водород	метил	оксетан-3-карбонил
040	водород	метил	метил	оксетан-3-карбонил
041	метил	водород	водород	оксетан-3-карбонил
042	метил	метил	водород	оксетан-3-карбонил

043	метил	водород	метил	оксетан-3-карбонил
044	метил	метил	метил	оксетан-3-карбонил
045	этил	водород	водород	оксетан-3-карбонил
046	этил	метил	водород	оксетан-3-карбонил
047	этил	водород	метил	оксетан-3-карбонил
048	этил	метил	метил	оксетан-3-карбонил

В таблице А-2 представлены 48 соединений от А-2.001 до А-2.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-3 представлены 48 соединений от А-3.001 до А-3.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-4 представлены 48 соединений от А-4.001 до А-4.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-5 представлены 48 соединений от А-5.001 до А-5.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой оксетан-3-ил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-6 представлены 48 соединений от А-6.001 до А-6.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой оксетан-3-ил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-7 представлены 48 соединений от А-7.001 до А-7.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-8 представлены 48 соединений от А-8.001 до А-8.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-9 представлены 48 соединений от А-9.001 до А-9.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

5 В таблице А-10 представлены 48 соединений от А-10.001 до А-10.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

10 В таблице А-11 представлены 48 соединений от А-11.001 до А-11.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

15 В таблице А-12 представлены 48 соединений от А-12.001 до А-12.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

20 В таблице А-13 представлены 48 соединений от А-13.001 до А-13.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метоксиэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-14 представлены 48 соединений от А-14.001 до А-14.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-метоксиэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

25 В таблице А-15 представлены 48 соединений от А-15.001 до А-15.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-изопропоксиэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

30 В таблице А-16 представлены 48 соединений от А-16.001 до А-16.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-изопропоксиэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-17 представлены 48 соединений от А-17.001 до А-17.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой 1-трет-

бутоксизтил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-18 представлены 48 соединений от A-18.001 до A-18.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой водород, R^1 представляет собой 1-трет-бутоксизтил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-19 представлены 48 соединений от A-19.001 до A-19.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой водород, R^1 представляет собой изопропоксиметил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-20 представлены 48 соединений от A-20.001 до A-20.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой водород, R^1 представляет собой изопропоксиметил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-21 представлены 48 соединений от A-21.001 до A-21.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой водород, R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-22 представлены 48 соединений от A-22.001 до A-22.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой водород, R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-23 представлены 48 соединений от A-23.001 до A-23.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-24 представлены 48 соединений от A-24.001 до A-24.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-25 представлены 48 соединений от A-25.001 до A-25.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-26 представлены 48 соединений от A-26.001 до A-26.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

5 В таблице A-27 представлены 48 соединений от A-27.001 до A-27.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой оксетан-3-ил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

10 В таблице A-28 представлены 48 соединений от A-28.001 до A-28.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой оксетан-3-ил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

15 В таблице A-29 представлены 48 соединений от A-29.001 до A-29.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

20 В таблице A-30 представлены 48 соединений от A-30.001 до A-30.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-31 представлены 48 соединений от A-31.001 до A-31.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

25 В таблице A-32 представлены 48 соединений от A-32.001 до A-32.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

30 В таблице A-33 представлены 48 соединений от A-33.001 до A-33.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице A-34 представлены 48 соединений от A-34.001 до A-34.048 формулы (Ib), где A представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₃, R¹ представляет собой 1-

метилсульфанилэтил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

5 В таблице А-35 представлены 48 соединений от А-35.001 до А-35.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-метоксиэтил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

10 В таблице А-36 представлены 48 соединений от А-36.001 до А-36.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-метоксиэтил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-37 представлены 48 соединений от А-37.001 до А-37.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-изопропоксиэтил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

15 В таблице А-38 представлены 48 соединений от А-38.001 до А-38.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-изопропоксиэтил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

20 В таблице А-39 представлены 48 соединений от А-39.001 до А-39.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-трет-бутоксиэтил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

25 В таблице А-40 представлены 48 соединений от А-40.001 до А-40.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой 1-трет-бутоксиэтил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

30 В таблице А-41 представлены 48 соединений от А-41.001 до А-41.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой изопропоксиметил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-42 представлены 48 соединений от А-42.001 до А-42.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой изопропоксиметил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-43 представлены 48 соединений от А-43.001 до А-43.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

5 В таблице А-44 представлены 48 соединений от А-44.001 до А-44.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_3$, R^1 представляет собой трет-бутоксиметил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

10 В таблице А-45 представлены 48 соединений от А-45.001 до А-45.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

15 В таблице А-46 представлены 48 соединений от А-46.001 до А-46.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

20 В таблице А-47 представлены 48 соединений от А-47.001 до А-47.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-48 представлены 48 соединений от А-48.001 до А-48.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

25 В таблице А-49 представлены 48 соединений от А-49.001 до А-49.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой оксетан-3-ил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

30 В таблице А-50 представлены 48 соединений от А-50.001 до А-50.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой оксетан-3-ил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-51 представлены 48 соединений от А-51.001 до А-51.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R^7 представляет собой $-C(O)_2CH_2CH_3$, R^1 представляет собой

1-метилсульфонилэтил, R^2 представляет собой водород, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-52 представлены 48 соединений от А-52.001 до А-52.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфонилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-53 представлены 48 соединений от А-53.001 до А-53.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-54 представлены 48 соединений от А-54.001 до А-54.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфинилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-55 представлены 48 соединений от А-55.001 до А-55.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-56 представлены 48 соединений от А-56.001 до А-56.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метилсульфанилэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-57 представлены 48 соединений от А-57.001 до А-57.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метоксиэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-58 представлены 48 соединений от А-58.001 до А-58.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-метоксиэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-59 представлены 48 соединений от А-59.001 до А-59.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-изопропоксиэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-60 представлены 48 соединений от А-60.001 до А-60.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-изопропоксиэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

5 В таблице А-61 представлены 48 соединений от А-61.001 до А-61.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-трет-бутоксиэтил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

10 В таблице А-62 представлены 48 соединений от А-62.001 до А-62.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой 1-трет-бутоксиэтил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

15 В таблице А-63 представлены 48 соединений от А-63.001 до А-63.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой изопропоксиметил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

20 В таблице А-64 представлены 48 соединений от А-64.001 до А-64.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой изопропоксиметил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-65 представлены 48 соединений от А-65.001 до А-65.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой трет-бутоксиметил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

25 В таблице А-66 представлены 48 соединений от А-66.001 до А-66.048 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой -C(O)₂CH₂CH₃, R¹ представляет собой трет-бутоксиметил, R² представляет собой фтор, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

30 В таблице А-67 представлены 12 соединений от А-67.001 до А-66.012 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой тетрагидропиран-4-ил, R² представляет собой водород, и R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ являются такими, как определено в таблице 1.

В таблице А-68 представлены 12 соединений от А-68.001 до А-68.012 формулы (Ib), где А представляет собой N, R⁷ представляет собой водород, R¹ представляет собой

тетрагидропиран-4-ил, R^2 представляет собой фтор, и R^4 , R^5 , R^6 и R^8 являются такими, как определено в таблице 1.

Примеры составов

<u>Смачиваемые порошки</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент [соединение формулы (I)]	25%	50%	75%
лигносульфонат натрия	5%	5%	-
лаурилсульфат натрия	3%	-	5%
диизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6%	10%
простой феноловый эфир полиэтиленгликоля (7-8 моль этиленоксида)	-	2%	-
высокодисперсная кремниевая кислота	5%	10%	10%
каолин	62%	27%	-

- 5 Активный ингредиент тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице, получая смачиваемые порошки, которые можно разбавить водой с получением суспензий требуемой концентрации.

<u>Порошки для сухой обработки семян</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент [соединение формулы (I)]	25%	50%	75%
легкое минеральное масло	5%	5%	5%
высокодисперсная кремниевая кислота	5%	5%	-
каолин	65%	40%	-
тальк	-		20%

- 10 Активный ингредиент тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице, получая порошки, которые можно применять непосредственно для обработки семян.

Эмульгируемый концентрат

активный ингредиент [соединение формулы (I)]	10%
простой октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля (4-5 моль этиленоксида)	3%
додецилбензолсульфонат кальция	3%

простой полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4%
циклогексанон	30%
смесь ксилолов	50%

Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любой необходимой степени разведения, которые можно применять для защиты растений.

<u>Пылевидные препараты</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент [соединение формулы (I)]	5%	6%	4%
тальк	95%	-	-
каолин	-	94%	-
минеральный наполнитель	-	-	96%

5

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем смешивания активного ингредиента с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице. Такие порошки также можно применять для вариантов сухого протравливания семян.

Экструдированные гранулы

активный ингредиент [соединение формулы (I)]	15%
лигносульфонат натрия	2%
карбоксиметилцеллюлоза	1%
каолин	82%

10

Активный ингредиент смешивают и измельчают со вспомогательными веществами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдировать и затем сушат в потоке воздуха.

Гранулы, покрытые оболочкой

активный ингредиент [соединение формулы (I)]	8%
полиэтиленгликоль (мол. масса 200)	3%
каолин	89%

15

Тонкоизмельченный активный ингредиент в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким способом получают непылевидные гранулы, покрытые оболочкой.

Суспензионный концентрат

активный ингредиент [соединение формулы (I)]	40%
пропиленгликоль	10%
полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида)	6%
лигносульфонат натрия	10%
карбоксиметилцеллюлоза	1%
силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	1%
вода	32%

5

Тонкоизмельченный активный ингредиент тщательно перемешивают со вспомогательными веществами, получая концентрат суспензии, из которого можно получить суспензии любой требуемой степени разбавления путем разведения водой. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

10

Текущий концентрат для обработки семян

активный ингредиент [соединение формулы (I)]	40%
пропиленгликоль	5%
сополимер бутанола и РО/ЕО	2%
тристиролфенол с 10-20 молями ЕО	2%
1,2-бензизотиазолин-3-он (в виде 20% раствора в воде)	0,5%
кальциевая соль моноазопигмента	5%
силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	0,2%
вода	45,3%

15

Тонкоизмельченный активный ингредиент тщательно перемешивают со вспомогательными веществами, получая концентрат суспензии, из которого можно получить суспензии любой требуемой степени разбавления путем разведения водой. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Капсульная суспензия медленного высвобождения

Смешивают 28 частей комбинации соединения формулы (I) с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилениполифенилизоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси из 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц требуемого размера. К этой эмульсии добавляют смесь из 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь взбалтывают до завершения реакции полимеризации.

Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. Состав капсульной суспензии содержит 28% активных ингредиентов. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон.

Полученный состав применяют в виде водной суспензии по отношению к семенам в подходящем для этой цели устройстве.

Примеры

Следующие примеры служат для иллюстрации настоящего изобретения. Соединения по настоящему изобретению могут отличаться от известных соединений благодаря более высокой эффективности при низких нормах применения, что способен проверить специалист в данной области с использованием экспериментальных методик, изложенных в разделе "Примеры", используя при необходимости более низкие нормы применения, например, 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm или 0,2 ppm.

Соединения формулы (I) могут обладать целым рядом преимуществ, в том числе, *inter alia*, преимущественными уровнями биологической активности для защиты растений от заболеваний, которые вызваны грибами, или превосходными свойствами для применения в качестве агрохимически активных ингредиентов (например, более высокая биологическая активность, преимущественный спектр активности, повышенный профиль безопасности (в том числе улучшенная толерантность сельскохозяйственных культур), улучшенные физико-химические свойства или повышенная биоразлагаемость).

Перечень сокращений

°C означает градусы Цельсия, CDCl₃ означает хлороформ-d, d означает дублет, DCM означает дихлорметан, DMF означает диметилформамид, HATU означает 1-[бис(диметиламино)метилени]-1*H*-1,2,3-триазоло[4,5-*b*]пиридиний-3-оксида

гексафторфосфат, m означает мультиплет, МГц означает мегагерц, н. означает нормальный, к. т. означает комнатную температуру, s означает синглет.

Общая процедура

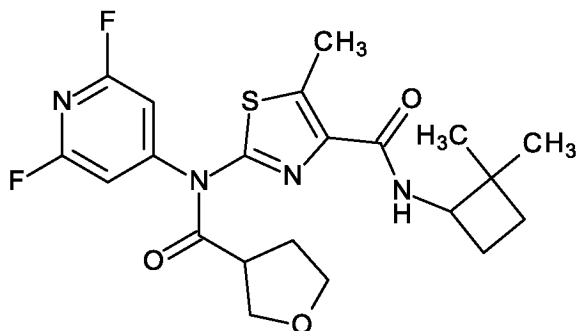
По всему данному описанию значения температуры приведены в градусах Цельсия (°C), а “т. пл.” означает температуру плавления. LC/MS означает жидкостную хроматографию – масс-спектрометрию, а описание устройства и способа следующее:

Способ А: ACQUITY UPLC от Waters, Waters UPLC HSS T3, размер частиц 1,8 мм, колонка 30 × 2,1 мм, 0,85 мл/мин, 60°C, H₂O/MeOH 95:5 + 0,05% HCOOH (90%) / CH₃CN + 0,05% HCOOH (10%) – 1,2 мин. – CH₃CN + 0,05% HCOOH (100%) – 0,30 мин, масс-спектрометр ACQUITY SQD от Waters, способ ионизации: электрораспыление (ESI), полярность: положительные ионы, напряжение на капилляре (кВ) 3,00, напряжение на конусе (В) 30,00, напряжение на экстракторе (В) 2,00, исходная температура (°C) 150, температура десольватации (°C) 350, газовый поток в конусе (л/час) 0, газовый поток десольватации (л/час) 650).

Способ В: ACQUITY UPLC от Waters, Waters UPLC HSS T3, размер частиц 1,8 мм, колонка 30 × 2,1 мм, 0,85 мл/мин, 60°C, H₂O/MeOH 95:5 + 0,05% HCOOH (90%) / CH₃CN + 0,05% HCOOH (10%) – 2,7 мин. – CH₃CN + 0,05% HCOOH (100%) – 0,30 мин, масс-спектрометр ACQUITY SQD от Waters, способ ионизации: электрораспыление (ESI), полярность: положительные ионы, напряжение на капилляре (кВ) 3,00, напряжение на конусе (В) 30,00, напряжение на экстракторе (В) 2,00, исходная температура (°C) 150, температура десольватации (°C) 350, газовый поток в конусе (л/час) 0, газовый поток десольватации (л/час) 650).

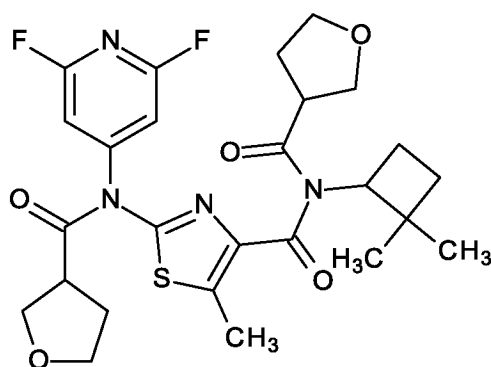
Способ С: Масс-спектрометр ACQUITY от Waters Corporations (одноквадрупольный масс-спектрометр SQD или SQDII), оснащенный источником электрораспыления (полярность: положительные или отрицательные ионы, напряжение на капилляре: 3,0 кВ, напряжение на конусе: 30 В, напряжение на экстракторе: 3,00 В, температура источника: 150°C, температура десольватации: 400°C, расход газа в конусе: 60 л/ч, расход газа для десольватации: 700 л/ч, диапазон масс: 140-800 Да), и ACQUITY UPLC от Waters Corporations с дегазатором растворителя, насосом для двухкомпонентных смесей, нагреваемым отделением для колонки и детектором на диодной матрице. Колонка: Waters UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 x 2,1 мм, температура: 60°C, диапазон значений длины волны DAD (нм): от 210 до 400, градиент растворителя: А = вода/метанол 9:1 + 0,1% муравьиной кислоты, В = ацетонитрил + 0,1% муравьиной кислоты, градиент: 0-100% В за 2,5 мин.; расход (мл/мин) 0,75.

Пример 1. Получение 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамида (пример Р-2, таблица 2) и 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагидрофуран-3-карбонил)тиазол-4-карбоксамида (пример Р-1, таблица 2)



(Соединение Р-3, таблица 2)

и



(Соединение Р-1, таблица 2)

Раствор тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты (0,174 г, 0,143 мл, 1,48 ммоль) в DCM (9 мл) в атмосфере аргона обрабатывали с помощью 1 капли DMF с последующим добавлением оксалилхлорида (0,192 г, 0,13 мл, 1,48 ммоль). Смесь перемешивали в течение 30 минут при к. т. в атмосфере аргона с получением тетрагидрофуран-3-карбонилхлорида. К данному раствору в DCM добавляли 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамида (0,350 г, 0,993 ммоль, полученный, как описано в WO 2019/105933) с последующим добавлением триэтиламина (0,308 г, 0,42 мл, 2,98 ммоль) в атмосфере аргона при к. т. Полученный бледно-желтый раствор перемешивали в течение 2,5 часов в атмосфере аргона при к. т. По истечении данного времени LCMS анализ показал завершение реакции. Реакционную смесь обрабатывали с помощью Isolute® и концентрировали *in vacuo*. В результате очистки посредством флэш-хроматографии с элюированием с помощью смеси этилацетат/циклогексан получали смесь двух продуктов, которую

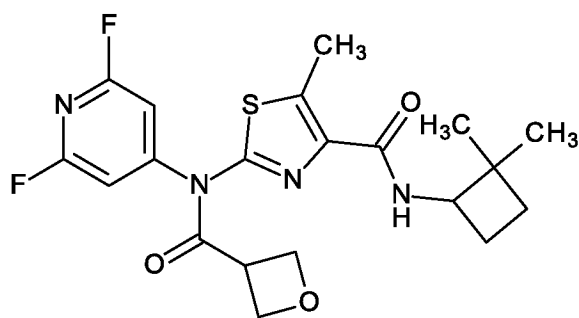
дополнительно очищали посредством хроматографии с обращенной фазой с получением в качестве первого элюированного продукта 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамида (пример Р-2, таблица 2) в виде белого порошка.

- 5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ ppm 0,94 (s, 3 H) 1,13 (s, 3 H) 1,49 - 1,59 (m, 2 H) 1,65 - 1,78 (m, 1 H) 1,95 - 2,15 (m, 1 H) 2,19 - 2,30 (m, 1 H) 2,30 - 2,40 (m, 1 H) 2,81 (s, 3 H) 2,99 - 3,14 (m, 1 H) 3,80 - 3,88 (m, 1 H) 3,88 - 3,95 (m, 1 H) 3,95 - 4,06 (m, 2 H) 4,10 - 4,26 (квадруплет, 1 H) 6,89 (s, 2 H) 6,95 - 7,06 (широкий d, 1 H);
LC-MS (Способ А): 451 [M+H], Rt: 1,09 мин.

- 10 В результате дополнительного элюирования получали второй продукт, 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагидрофуран-3-карбонил)тиазол-4-карбоксамида, (соединение Р-1, таблица 2) в виде белого порошка.

- 15 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ ppm 1,09 (s, 3 H) 1,18 (s, 3 H) 1,53 - 1,66 (m, 2 H) 1,77 - 1,91 (m, 1 H) 2,07 - 2,22 (m, 2 H) 2,23 - 2,34 (m, 1 H) 2,41 - 2,51 + 2,62 - 2,71 (2 x m, 2 H) 2,81 (s, 3 H) 3,10 - 3,26 (m, 1 H) 3,77 - 4,05 (m, 6 H) 4,14 - 4,31 + 4,37 - 4,43 (2 x m, 3 H) 6,81 - 6,92 (2 x s, 2 H) 7,20 (br d, $J=8,44$ Гц, 1 H);
LC-MS (Способ А): 549 [M+H], Rt: 1,15 мин.

- 20 **Пример 2.** Получение 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(оксетан-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамида (пример Р-4, таблица 2)



(Пример Р-4, таблица 2)

- 25 Раствор 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамида (0,050 г, 1,0, 0,14 ммоль, полученного, как описано в WO 2019/105933), в DMF (1,4 мл) обрабатывали оксетан-3-карбоновой кислотой (0,019 г, 1,2, 0,17 ммоль), N,N-диизопропилэтиламином (0,048 г, 0,064 мл, 0,37 ммоль) и НАТУ (0,082 г, 0,21 ммоль). Полученный бледно-коричневый раствор перемешивали в течение 4 часов при к. т. По истечении этого времени реакционную смесь гасили насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и разбавляли водой. Затем ее

экстрагировали дважды с помощью этилацетата, и объединенные органические слои промывали солевым раствором, высушивали над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo* с получением бледно-коричневого масла. Неочищенный продукт очищали посредством хроматографии с обращенной фазой с элюированием с помощью смеси ацетонитрил/вода с получением указанного в заголовке соединения в виде бежевого порошка.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ ppm 0,97 (s, 3 H) 1,14 (s, 3 H) 1,50 - 1,65 (m, 2 H) 1,65 - 1,81 (m, 1 H) 2,19 - 2,34 (m, 1 H) 2,84 (s, 3 H) 3,86 - 4,01 (m, 1 H) 4,13 - 4,26 (m, 1 H) 4,51 - 4,65 (m, 2 H) 4,92 - 5,06 (m, 2 H) 6,82 (s, 2 H) 6,91 - 7,08 (br s, 1 H);

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

Пример 3. Получение 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)-(тетрагидропиран-4-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (пример Р-11, таблица 2)

Раствор тетрагидро-2h-пиран-4-карбоновой кислоты (6,282 г, 46,82 ммоль) в ацетонитриле (86 мл) обрабатывали ангидридом 1-пропанфосфоновой кислоты (99,32 г, 93,00 мл, 156,1 ммоль), N,N-диизопропилэтиламино (40,75 г, 54,6 мл, 10,00, 312,1 ммоль) и добавляли 2-[(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид (11 г, 1,000, 31,21 ммоль, полученный, как описано в WO 2019/105933) с получением коричневого раствора.

Реакционную смесь перемешивали в течение 16 ч при 50°C в атмосфере аргона. После завершения реакции обеспечивали охлаждение реакционной смеси и медленно добавляли в водный насыщенный раствор бикарбоната натрия при 0°C. Реакционную смесь затем экстрагировали с помощью этилацетата (x3) и объединенные органические экстракты промывали один раз солевым раствором, высушивали над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo* с получением 15,88 г бледно-коричневого порошка. Посредством флэш-хроматографии с элюированием с помощью смеси этилацетат/циклогексан получали указанный в заголовке продукт в виде белого порошка. ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ ppm 0,93 (s, 3 H) 1,13 (s, 3 H) 1,50 - 1,76 (m, 5 H) 1,97 - 2,09 (m, 2 H) 2,25 (dtd, $J=10,90$, 8,08, 8,08, 2,72 Гц, 1 H) 2,60 (tt, $J=11,26$, 3,81 Гц, 1 H) 2,81 (s, 3 H) 3,29 (tt, $J=11,90$, 1,91 Гц, 2 H) 4,01 (dt, $J=11,63$, 2,18 Гц, 2 H) 4,18 (q, $J=8,60$ Гц, 1 H) 6,89 (s, 2 H) 6,99 (br d, $J=9,08$ Гц, 1 H)

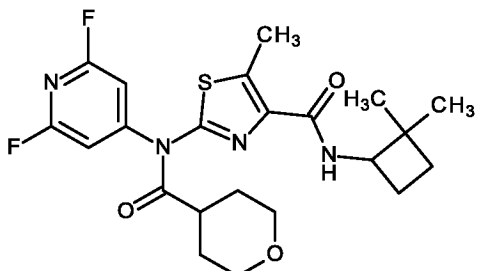
LC-MS (Способ А): 465 [M+H], Rt: 1,11 мин.

В таблице 2 ниже проиллюстрированы отдельные соединения формулы (I) в качестве примера в соответствии с настоящим изобретением.

Таблица 2. Температура плавления и данные LC/MS (R_t = время удерживания) для выбранных соединений из таблицы 1

№	Название соединения	Структура	Мр (°C)	LC/MS
P-1	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-N-(тетрагидрофуран-3-карбонил)тиазол-4-карбоксамид			R_t = 1,15 минуты (A); MS: масса/заряд = 549 (M+1)
P-2	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-2-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R_t = 1,13 минуты (A); MS: масса/заряд = 451 (M+1)
P-3	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(тетрагидрофуран-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R_t = 1,09 минуты (A); MS: масса/заряд = 451 (M+1)
P-4	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(оксетан-3-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R_t = 1,05 минуты (A); MS: масса/заряд = 437 (M+1)
P-5	2-[2-трет-Бутоксипропанонил-(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид		107-112	R_t = 1,22 минуты (A); MS: масса/заряд = 481 (M+1)

№	Название соединения	Структура	Мр (°C)	LC/MS
P-6	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(2-изопропоксипропанон)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R _t = 1,20 минуты (A); MS: масса/заряд = 467 (M+1)
P-7	2-[(2-трет-Бутоксияцетил)-(2,6-дифтор-4-пиридил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид		159-161	R _t = 1,20 минуты (A); MS: масса/заряд = 467 (M+1)
P-8	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(2-изопропоксиацетил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид		170-172	R _t = 1,16 минуты (A); MS: масса/заряд = 453 (M+1)
P-9	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(2-метоксипропанон)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R _t = 1,12 минуты (A); MS: масса/заряд = 439 (M+1)
P-10	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(2-метилсульфонилпропанон)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R _t = 1,02 минуты (A); MS: масса/заряд = 487 (M+1)

№	Название соединения	Структура	Мр (°C)	LC/MS
P-11	2-[(2,6-Дифтор-4-пиридил)-(тетрагидропиран-4-карбонил)амино]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тиазол-4-карбоксамид			R _t = 1,11 минуты (A); MS: масса/заряд = 465 (M+1)

Биологические примеры

Пример В1. *Alternaria solani* / томат / листовой диск (альтернариоз)

Листовые диски томата сорта Baby помещали на агар в многолуночных планшетах (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Листовые диски инокулировали суспензией спор гриба через 2 дня после применения. Инокулированные листовые диски инкубировали при 23°C/21°C (день/ночь) и относительной влажности 80% при световом режиме 12/12 ч. (света/темноты) в климатической камере и оценивали активность соединения как показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных листовых дисках, представляющих собой контрольные диски (5-7 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Alternaria solani* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 и P-11.

Пример В2. *Botryotinia fuckeliana* (*Botrytis cinerea*) / жидкая культура (серая гниль)

Конидии грибов из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (бульон Вогеля). После внесения раствора (DMSO) исследуемого соединения в планшеты для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически определяли подавление роста через 3-4 дня после применения. Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Botryotinia fuckeliana* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-2 и P-4.

Пример В3. *Glomerella lagenarium* (*Colletotrichum lagenarium*) / жидкая культура (антракноз)

Конидии грибов из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном, PDB). После внесения раствора (DMSO) исследуемого соединения в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически измеряли подавление роста через 3-4 дня после применения. Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Glomerella lagenarium* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-6, P-9, P-10 и P-11.

Пример В4. *Blumeria graminis f. sp. tritici* (*Erysiphe graminis f. sp. tritici*) / пшеница / предупреждение заражения листового диска (мучнистая роса пшеницы)

Сегменты листьев пшеницы сорта Kanzler помещали на агар в многолуночном планшете (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Листовые диски инокулировали путем встряхивания зараженных мучнистой росой растений над тестовыми планшетами через 1 день после применения. Инокулированные листовые диски инкубировали при 20°C и относительной влажности 60% при световом режиме 24 ч. темноты, затем 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных сегментах листьев (6-8 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Blumeria graminis f. sp. tritici* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-8, P-9, P-10 и P-11.

Пример В5. *Phaeosphaeria nodorum* (*Septoria nodorum*) / пшеница / предупреждение заражения листового диска (септориоз колосковой чешуи)

Сегменты листьев пшеницы сорта Kanzler помещали на агар в многолуночном планшете (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Листовые диски инокулировали суспензией спор гриба через 2 дня после применения. Инокулированные тестируемые листовые диски

инкубировали при 20°C и относительной влажности 75% при световом режиме 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных листовых дисках (5-7 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Phaeosphaeria nodorum* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-2, P-3 и P-10.

10 **Пример В6. *Monographella nivalis* (*Microdochium nivale*)** / жидкая культура (корневая гниль злаковых)

Конидии грибов из криогенного хранилища непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном, PDB). После внесения раствора (DMSO) исследуемого соединения в планшет для микротитрования (96-
15 луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически определяли подавление роста через 4-5 дней после применения. Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Monographella nivalis* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях
20 демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 и P-11.

Пример В7. *Mycosphaerella arachidis* (*Cercospora arachidicola*) / жидкая культура (ранний церкоспороз листьев)

Конидии грибов из криогенного хранилища непосредственно смешивали с
25 питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном, PDB). После внесения раствора (DMSO) исследуемого соединения в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически определяли подавление роста через 4-5 дней после применения. Следующие
30 соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Mycosphaerella arachidis* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2 и P-10.

Пример В8. *Phakopsora pachyrhizi* / соя / предупреждение заражения (ржавчина сои)

Листовые диски сои помещали на водный агар в многолуночных планшетах (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Через один день после применения листовые диски инокулировали путем распыскивания суспензии спор на нижнюю поверхность листка. После периода инкубации в климатической камере, составляющего 24-36 часов, в темноте при 20°C и относительной влажности 75% листовой диск выдерживали при 20°C при режиме 12 ч. света/день и относительной влажности 75%. Оценивали активность соединения как показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных листовых дисках (12-14 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Phakopsora pachyrhizi* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-2, P-3, P-4, P-6 и P-9.

Пример В9. *Puccinia recondita f. sp. tritici* / пшеница / лечение заражения листового диска (бурая ржавчина)

Сегменты листьев пшеницы сорта Kanzler помещали на агар в многолуночных планшетах (24-луночный формат). Сегменты листьев инокулировали суспензией спор гриба. Планшеты хранили в темноте при 19°C и относительной влажности 75%. Составленное тестируемое соединение, разбавленное в воде, применяли через 1 день после инокуляции. Сегменты листьев инкубировали при 19°C и относительной влажности 75% при световом режиме 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных сегментах листьев (6-8 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Puccinia recondita f. sp. tritici* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9 и P-11.

Пример В10. *Puccinia recondita f. sp. tritici* / пшеница / предупреждение заражения листового диска (бурая ржавчина)

Сегменты листьев пшеницы сорта Kanzler помещали на агар в многолуночных планшетах (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым

соединением, разбавленным в воде. Листовые диски инокулировали суспензией спор гриба через 1 день после применения. Инокулированные сегменты листьев инкубировали при 19°C и относительной влажности 75% при световом режиме 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как

5 показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных сегментах листьев (7-9 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* при 200 ppm по сравнению с необработанным

10 контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-9, P-10 и P-11.

Пример В11. *Magnaporthe grisea* (*Pyricularia oryzae*) / рис / предупреждение заражения листового диска (пирикуляриоз риса)

Сегменты листьев риса сорта Ballila помещали на агар в многолуночный планшет

15 (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Сегменты листьев инокулировали суспензией спор гриба через 2 дня после применения. Инокулированные сегменты листьев инкубировали при 22°C и относительной влажности 80% при световом режиме 24 ч. темноты, затем 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как

20 показатель контроля заболевания, выраженный в процентах, по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных сегментах листьев (5-7 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Magnaporthe grisea* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем,

25 который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-7, P-8, P-9 и P-10.

Пример В12. *Pyrenophora teres* / ячмень / предупреждение заражения листового диска (сетчатая пятнистость)

Сегменты листьев ячменя сорта Hasso помещали на агар в многолуночном

30 планшете (24-луночный формат) и опрыскивали составленным тестируемым соединением, разбавленным в воде. Сегменты листьев инокулировали суспензией спор гриба через 2 дня после применения. Инокулированные сегменты листьев инкубировали при 20°C и относительной влажности 65% при световом режиме 12 ч. света/12 ч. темноты в климатической камере и оценивали активность соединения как

показатель контроля заболевания по сравнению с необработанным материалом при проявлении соответствующей степени повреждения вследствие заболевания на необработанных контрольных сегментах листьев (5-7 дней после применения). Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Pyrenophora* 5 *terres* при 200 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-5, P-6, P-9, P-10 и P-11.

Пример B13. *Sclerotinia sclerotiorum* / жидкая культура (белая гниль)

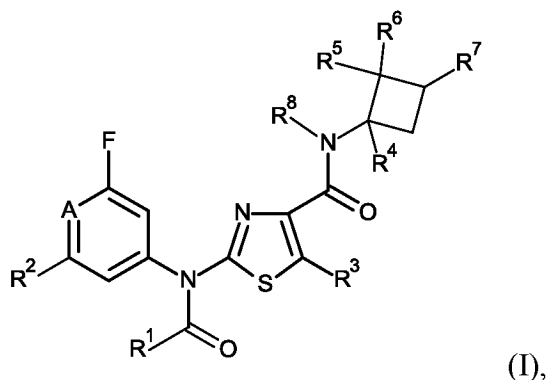
Фрагменты мицелия недавно выращенной культуры гриба в жидкой среде 10 непосредственно смешивали с питательным бульоном (картофельно-декстрозный бульон PDB). После внесения раствора (DMSO) тестируемого соединения в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий грибной материал. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически определяли подавление роста через 3-4 дня после 15 применения. Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Sclerotinia sclerotiorum* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-10.

Пример B14: *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) / жидкая культура (септориоз)

Конидии грибов из криогенного хранилища непосредственно смешивали с 20 питательным бульоном (картофельно-декстрозным бульоном, PDB). После внесения раствора (DMSO) исследуемого соединения в планшет для микротитрования (96-луночный формат) добавляли питательный бульон, содержащий споры грибов. Планшеты с тестируемым соединением инкубировали при 24°C и фотометрически 25 определяли подавление роста через 4-5 дней после применения. Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль *Mycosphaerella graminicola* при 20 ppm по сравнению с необработанным контролем, который при тех же условиях демонстрировал обширное развитие заболевания: P-1, P-2, P-3, P-4, P-9, P-10 и P-11.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I),



(I),

5 где

A представляет собой C-H или N;

R¹ представляет собой C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

R² представляет собой водород или галоген;

R³ представляет собой C₁-C₈алкил;

каждый из R⁴, R⁵, R⁶ независимо представляет собой водород или C₁-C₄алкил;

15 R⁷ представляет собой водород, C₁-C₄алкил, C₁-C₆алкоксикарбонилC₁-C₄алкил, C₁-C₆алкоксикарбонил или C₁-C₆алкокси;

R⁸ представляет собой водород, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфанилC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкилкарбонил или гетероциклилкарбонил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

или его соль или N-оксид.

25 2. Соединение по п. 1, где R¹ представляет собой C₁-C₄алкоксиC₁-C₂алкил, C₁-C₃алкилсульфанилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфинилC₁-C₃алкил, C₁-C₃алкилсульфонилC₁-C₃алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент

представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.

3. Соединение по п. 1 или п. 2, где R^1 представляет собой C_3 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.
4. Соединение по п. 1 или п. 2, где R^1 представляет собой изопропоксиметил, трет-бутоксиметил, 1-метоксиэтил, 1-изопропоксиэтил, 1-трет-бутоксиэтил, 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил или тетрагидропиран-4-ил.
5. Соединение по любому из пп. 1-3, где R^1 представляет собой C_1 - C_3 алкилсульфанил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфинил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфонил C_1 - C_3 алкил или гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из азота и кислорода.
6. Соединение по любому из пп. 1-3 или п. 5, где R^1 представляет собой 1-метилсульфонилэтил, оксетан-3-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил или тетрагидропиран-4-ил.
7. Соединение по любому из пп. 1-6, где R^2 представляет собой водород или фтор.
8. Соединение по любому из пп. 1-6, где R^3 представляет собой метил.
9. Соединение по любому из пп. 1-7, где R^4 представляет собой водород.
10. Соединение по любому из пп. 1-9, где R^5 и R^6 одновременно представляют собой метил.

11. Соединение по любому из пп. 1-10, где А представляет собой N.

12. Агрохимическая композиция, содержащая фунгицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-11.

5

13. Композиция по п. 12, дополнительно содержащая по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент и/или агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

10 14. Способ осуществления контроля или предупреждения заражения полезных растений фитопатогенными микроорганизмами, где фунгицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-11 или композиции по п. 12 или п. 13 применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.

15

15. Применение соединения формулы (I) по любому из пп. 1-11 в качестве фунгицида.