



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2013114227/13, 01.09.2011

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
01.09.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
01.09.2010 US 61/378,982;  
23.11.2010 US 61/416,346;  
01.02.2011 US 61/438,356;  
21.07.2011 US 61/510,137

(43) Дата публикации заявки: 10.10.2014 Бюл. № 28

(45) Опубликовано: 27.12.2015 Бюл. № 36

(56) Список документов, цитированных в отчете о  
поиске: JP 8208620 A 13.08.1996. US 5849778 A  
15.12.1998. UZ 3345 C 31.05.2007. EA 9517 B1  
28.02.2008.(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 01.04.2013(86) Заявка РСТ:  
US 2011/050124 (01.09.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2012/031061 (08.03.2012)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городиский и  
Партнеры"

(72) Автор(ы):

ЛОНГ Джеффри Кит (US),  
ГРЕГОРИ Ванн (US),  
ГАТТРИДЖ Стивен (US),  
ТАГГИ Эндрю Эдмунд (US),  
БЕРЕЗНАК Джеймс Франсис (US)

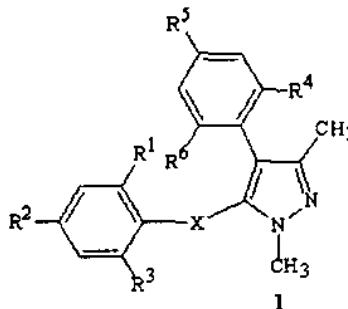
(73) Патентообладатель(и):

Е.И. ДЮПОН ДЕ НЕМУР ЭНД  
КОМПАНИ (US)

## (54) ФУНГИЦИДНЫЕ ПИРАЗОЛЫ И ИХ СМЕСЬ (ВАРИАНТЫ)

(57) Реферат:

Изобретение относится к сельскому хозяйству.  
Фунгицидная композиция содержит: (а) по  
меньшей мере одно соединение, выбранное из  
соединений формулы 1, их N-оксидов и солей:



где X представляет собой NH; R<sup>1</sup> представляет собой галоген; R<sup>2</sup> представляет собой H; R<sup>3</sup> представляет собой галоген; R<sup>4</sup> представляет собой галоген; R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и R<sup>6</sup> представляет собой H или галоген; и (b) по меньшей мере одно добавочное фунгицидное соединение, при условии, что когда R<sup>1</sup> представляет собой F, то

R<sup>3</sup> представляет собой Cl, и когда R<sup>1</sup> представляет собой Cl, то R<sup>3</sup> представляет собой F. Осуществляют контроль болезней растений, вызванных патогенными грибами путем нанесения на растение, или его часть, или на семя растения фунгицидно эффективного количества соединения формулы 1, его N-оксида или соли. Изобретение позволяет повысить эффективность борьбы. 9 н. и 15 з.п. ф-лы, 26 табл.

R U 2 5 7 2 2 0 2 C 2

R U 2 5 7 2 2 0 2 C 2



FEDERAL SERVICE  
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.  
*A01N 43/48* (2006.01)  
*A01N 43/56* (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21)(22) Application: 2013114227/13, 01.09.2011

(24) Effective date for property rights:  
01.09.2011

Priority:

(30) Convention priority:  
01.09.2010 US 61/378,982;  
23.11.2010 US 61/416,346;  
01.02.2011 US 61/438,356;  
21.07.2011 US 61/510,137

(43) Application published: 10.10.2014 Bull. № 28

(45) Date of publication: 27.12.2015 Bull. № 36

(85) Commencement of national phase: 01.04.2013

(86) PCT application:  
US 2011/050124 (01.09.2011)(87) PCT publication:  
WO 2012/031061 (08.03.2012)

Mail address:

129090, Moskva, ul. B. Spasskaja, 25, stroenie 3,  
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery"

(72) Inventor(s):

LONG Dzheffri Kit (US),  
GREGORI Vann (US),  
GATTRIDZh Stiven (US),  
TAGGI Ehndrju Ehdmond (US),  
BEREZNAK Dzhejms Fransis (US)

(73) Proprietor(s):

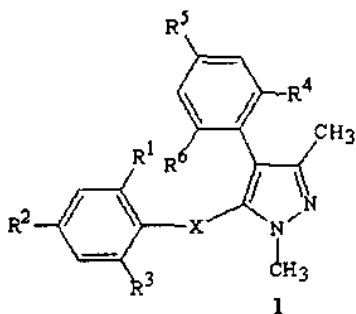
E.I. DJuPON DE NEMUR EhND KOMPANI  
(US)(54) **FUNGICIDAL PYRAZOLES AND THEIR MIXTURE (VERSIONS)**

(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to agriculture.

Fungicidal composition contains: (a) at least one compound, selected from compounds of formula 1, their N-oxides and salts:



where X represents NH; R<sup>1</sup> represents halogen; R<sup>2</sup> represents H; R<sup>3</sup> represents halogen; R<sup>4</sup> represents halogen; R<sup>5</sup> represents H, cyano, halogen or C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkoxy; and R<sup>6</sup> represents H or halogen; and (b) at least one additional fungicidal compound, on condition, that when R<sup>1</sup> represents F, then R<sup>3</sup> represents Cl, and when R<sup>1</sup> represents Cl, then R<sup>3</sup> represents F. Control of diseases of plants, caused by pathogenic fungi, by application on plant or its part, or on plant seed of fungicidally effective quantity of formula 1 compound, its N-oxide or salt, is realised.

EFFECT: invention makes it possible to increase control efficiency.

24 cl, 26 tbl

## ОБЛАСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к определенным пиразольным производным, их N-оксидам и солям, к смесям и композициям, содержащим такие пиразольные производные, а также к способам применения таких пиразольных производных, их

5 смесей и композиций в качестве фунгицидов.

## ПРЕДПОСЫЛКИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Контроль болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, чрезвычайно важен в достижении высокой производительности сельскохозяйственных культур. Болезнь растений, повреждающая декоративные, овощные, полевые, зерновые

10 и плодовые сельскохозяйственные культуры, может вызывать значительное снижение продуктивности и в связи с этим приводит к повышенной стоимости для потребителя. В дополнение к тому, что болезни растений зачастую сильно губительны, их тяжело контролировать, и они могут развивать резистентность к промышленным фунгицидам. Для этих целей доступно множество продуктов, однако остается потребность в новых

15 фунгицидных соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды или имеют различные области применения. Кроме внесения новых фунгицидов, часто применяются комбинации фунгицидов для облегчения контроля болезней, для расширения спектра контроля и для замедления развития резистентности. Кроме того, определенные немногочисленные

20 комбинации фунгицидов демонстрируют эффект, превосходящий аддитивный (т.е. синергический), что обеспечивает важные с промышленной точки зрения уровни контроля болезней растений. В области техники известно, что преимущества конкретных комбинаций фунгицидов изменяются в зависимости от таких факторов, как конкретный вид растения и болезнь растения, подлежащая лечению, и того, производится ли лечение

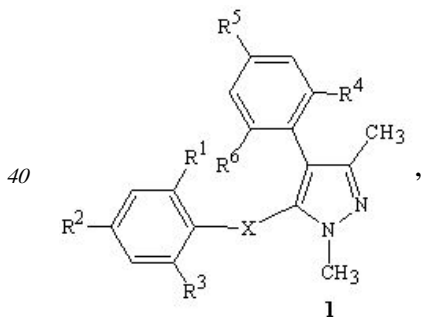
25 растения перед или после инфицирования патогенными грибами растений. В соответствии с этим необходимы новые эффективные комбинации для обеспечения наилучшего соответствия конкретным требованиям контроля болезней растений. К настоящему времени такие комбинации уже раскрыты. В JP08208620 раскрываются N-фенил-пиразолиламиновые производные в качестве инсектицидов, гербицидов и

30 фунгицидов; однако фунгицидные пиразолы настоящего изобретения и их смеси не раскрываются в данной публикации.

## КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к фунгицидной композиции (т.е. комбинации), содержащей (а) по меньшей мере одно соединение, выбранное из соединений формулы

35 1 (включая все стереоизомеры), их N-оксидов и солей:



45 где

X представляет собой СНОН, О или NH;

R<sup>1</sup> представляет собой галоген или метил;

R<sup>2</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси;

R<sup>3</sup> представляет собой H, галоген или метил;

R<sup>4</sup> представляет собой галоген;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и

R<sup>6</sup> представляет собой H или галоген; и

(b) по меньшей мере одно дополнительное фунгицидное соединение.

Настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей: (a) по меньшей мере одно соединение, выбранное из соединений формулы 1, описанной выше, их N-оксидов и солей, а также по меньшей мере одного соединения или средства для контроля беспозвоночных вредителей.

Настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей одну из вышеуказанных композиций, содержащей компонент (a) и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Настоящее изобретение также относится к способу контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, включающему нанесение на растение или его часть, или на семя растения фунгицидно эффективного количества одной из вышеуказанных композиций.

Вышеописанный способ можно также описать как способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий нанесение фунгицидно эффективного количества одной из вышеуказанных композиций на растение (или его часть) или семя растения (непосредственно или через окружающую среду (например, среда для выращивания) растения или семени растения).

Настоящее изобретение также относится к соединению формулы 1, описанной выше, или к его N-оксиду, или соли. Настоящее изобретение дополнительно относится к фунгицидной композиции, содержащей соединение формулы 1 или его N-оксид, или соль, а также по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. Настоящее изобретение также дополнительно относится к способу защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающему фунгицидно эффективное количество соединения формулы 1 или его N-оксида, или соли для растения или семени растения.

#### ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

Подразумевается, что используемые в данном документе выражения “содержит”, “содержащий”, “включает”, “включающий”, “имеет”, “имеющий”, “вмещает”, “вмещающий”, “характеризующийся тем, что” или любые другие их вариации распространяются на неисключительное включение, если явно не указано какое-либо ограничение. Например, композиция, смесь, процесс или способ, который содержит перечень элементов, необязательно ограничивается только данными элементами, но может включать другие элементы, не перечисленные прямо или неотделимые от такой композиции, смеси, процесса или способа.

Переходная фраза “состоящий из” исключает любой не указанный элемент, стадию или ингредиент. Находясь в пункте формулы, подобное будет ограничивать пункт формулы по отношению включения иных материалов, чем перечисляемые, за исключением примесей, обычно ассоциированных с ними. Если фраза “состоящий из” появляется в отличительной части пункта формулы, а не непосредственно за ограничительной частью, она ограничивает только элемент, изложенный в такой отличительной части; другие элементы не исключаются из пункта формулы в целом.

Переходная фраза “состоящий по существу из” применяется для обозначения композиции или способа, что включает материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы в дополнение к буквально раскрываемым, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы в существенной степени не влияют на основную и новую характеристику(и) заявленного изобретения. Выражение “состоящий по существу из” занимает среднюю позицию между “содержащий” и “состоящий из”.

Если заявители определили изобретение или его часть неограниченным выражением, таким как “содержащий”, следует сразу понимать, что (если не указано иное) описание следует истолковывать как также описывающее такое изобретение с применением выражений “состоящий по существу из” или “состоящий из”.

Кроме того, если определено не указано противоположное, “или” относится к «включающему» или, а не к «исключающему» или. Например, условию А или В удовлетворяет любое из следующего: А истинно (или присутствует) и В ложно (или не присутствует), А ложно (или не присутствует) и В истинно (или присутствует), а также как А, так и В истинные (или присутствуют).

Также подразумевается, что единственное число элемента или компонента настоящего изобретения является неограниченным относительно числа случаев (т.е. встречаемости) элемента или компонента. Следовательно, единственное число следует понимать, как включающее один или по меньшей мере один, и форма единственного числа элемента или компонента также включает множественное число, кроме случаев, где очевидно, что число подразумевается как единственное.

Как изложено в настоящем раскрытии и формуле изобретения, “растение” включает членов царства Растения, в частности, семенные растения (Spermatopsida), на всех жизненных стадиях, включая молодые растения (например, прорастающие семена, развивающиеся в сеянцы) и зрелые, репродуктивные стадии (например, растения, образующие цветы и семена). Части растений включают геотропические органы, обычно растущие под поверхностью среды для выращивания (например, почвы), такие как корни, клубни, луковичи и клубнелуковичи, и также органы, растущие над средой для выращивания, такие как листва (включая стебли и листья), цветы, плоды и семена.

Как изложено в данном документе, выражение “сеянец”, применяемое или отдельно, или в комбинации слов, означает молодое растение, развивающееся из зародыша семени.

В вышеизложенных перечислениях выражение “алкокси” включает, например, метокси и этокси. Выражение “галоген” включает фтор, хлор, бром или иод.

Общее число атомов углерода в замещающей группе обозначается приставкой “C<sub>i</sub>-C<sub>j</sub>”, где *i* и *j* являются числами от 1 до 2.

Соединения, относящиеся к композициям и способам настоящего изобретения, могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантиомеры, диастереомеры, атропоизомеры и геометрические изомеры.

Специалист в данной области поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять положительные эффекты, будучи обогащенным по сравнению с другим стереоизомером(ами) или отделенным от другого стереоизомера (ов). Кроме того, специалист знает как отделять, обогащать и/или избирательно получать указанные стереоизомеры. Соединения в композициях настоящего изобретения могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, отдельных стереоизомеров или в виде оптически активной формы.

Синтетические способы получения N-оксидов гетероциклов, таких как пиразолы, хорошо известны специалистам в данной области, в том числе окисление гетероциклов

перкислотами, такими как перуксусная и м-хлорпербензойная кислота (MCPBA), перекисью водорода, гидроперекисями алкилов, такими как гидроперекись трет-бутила, перборатом натрия и диоксиранами, такими как диметилдиоксиран. Такие способы получения N-оксидов были подробно описаны и обсуждены в литературе, см., например:

5 T. L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and

10 A. J. Boulton, Eds., Academic Press; и G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалист в данной области понимает, в связи с тем, что в окружающей среде и при физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, соли разделяют биологическую полезность несолевых форм. Таким образом, широкое разнообразие солей соединений формулы 1, отдельно и в смесях, применимы для контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений (т.е. подходящие для сельского хозяйства). Соли соединений формулы 1 включают соли присоединения кислоты с неорганическими или

15 органическими кислотами, такими как бромистоводородная, соляная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. В соответствии с этим настоящее изобретение относится к смесям соединений, выбранных из формулы 1, их N-оксидов и подходящих для сельского хозяйства солей.

20 Соединения, выбранные из формулы 1, стереоизомеры, таутомеры, N-оксиды и их соли, как правило, существуют в более чем одной форме, и формула 1, таким образом, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые представляет формула 1. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воск и смолы, а также

25 варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют по существу единый кристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют смесь из полиморфов (т.е. различные кристаллические типы). Выражение "полиморф" относится к конкретной кристаллической форме химического

30 соединения, которое может кристаллизоваться в различные кристаллические формы, причем эти формы имеют различные расположения и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковую химическую композицию, они также могут отличаться в композиции из-за присутствия или отсутствия сокристаллизованных воды или иных молекул, которые могут быть слабо или сильно

35 связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, точка плавления, гигроскопичность, способность суспендироваться, скорость растворения и биологическая доступность. Специалист в данной области поймет, что полиморф соединения, представленного формулой 1, может

40 проявлять положительные эффекты (например, возможность применения для получения полезных составов, улучшенная биологическая эффективность) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения, представленного формулой 1. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения, представленного

формулой 1, может быть достигнуто посредством способов, известных специалистам в данной области, в том числе, например, кристаллизацией с применением выбранных растворителей и температур.

Как описано в кратком описании настоящего изобретения, аспект настоящего изобретения направлен на композицию, содержащую (а) по меньшей мере одно соединение, выбранное из формулы 1, его N-оксидов и солей, и (b) по меньшей мере одно дополнительное фунгицидное соединение. Более конкретно, компонент (b) выбирают из группы, состоящей из:

- (b1) метилбензимидазолкарбаматных (МВС) фунгицидов
- 10 (b2) дикарбоксимидных фунгицидов;
- (b3) фунгицидов-ингибиторов деметилирования (DMI);
- (b4) фениламидных фунгицидов;
- (b5) амин/морфолиновых фунгицидов;
- (b6) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза фосфолипидов;
- 15 (b7) карбоксамидных фунгицидов;
- (b8) гидрокси(2-амино-)пиримидиновых фунгицидов;
- (b9) анилопиримидиновых фунгицидов;
- (b10) N-фенилкарбаматных фунгицидов;
- (b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинон-связывающего участка (QoI);
- 20 (b12) фенилпиррольных фунгицидов;
- (b13) хинолиновых фунгицидов;
- (b14) фунгицидов-ингибиторов перекисного окисления липидов;
- (b15) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на редуктазу (МВІ-  
R);
- 25 (b16) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на дегидратазу (МВІ-  
D);
- (b17) гидроксианилидных фунгицидов;
- (b18) фунгицидов-ингибиторов сквален-эпоксидазы;
- (b19) полиоксиновых фунгицидов;
- 30 (b20) фенилмочевинных фунгицидов;
- (b21) фунгицидов-ингибиторов внутреннего хинон-связывающего участка (QiI);
- (b22) бензамидных фунгицидов;
- (b23) антибиотических фунгицидов на основе енопирануроновой кислоты;
- (b24) гексопиранозильных антибиотических фунгицидов;
- 35 (b25) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на синтез белка;
- (b26) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на трегалазу  
и биосинтез инозитола;
- (b27) цианоацетамидоксимовых фунгицидов;
- (b28) карбаматных фунгицидов;
- 40 (b29) фунгицидов, разобщающих окислительное фосфорилирование;
- (b30) фунгицидов на основе органических соединений олова;
- (b31) фунгицидов на основе карбоновых кислот;
- (b32) гетероароматических фунгицидов;
- (b33) фосфонатных фунгицидов;
- 45 (b34) фунгицидов на основе фталамовой кислоты;
- (b35) бензотриазиновых фунгицидов;
- (b36) бензол-сульфонамидных фунгицидов;
- (b37) пиридазиновых фунгицидов;

- (b38) тиофен-карбоксамидных фунгицидов;
- (b39) пиримидинамидных фунгицидов;
- (b40) фунгицидов на основе амидов карбоновых кислот (САА);
- (b41) тетрациклиновых антибиотических фунгицидов;
- 5 (b42) тиокарбаматных фунгицидов;
- (b43) бензамидных фунгицидов;
- (b44) фунгицидов для индукции защиты растения-хозяина;
- (b45) фунгицидов с контактной активностью, действующих на множество участков;
- (b46) иных фунгицидов, чем фунгициды из компонента (а) и компонентов (b1)-(b45);

10 и

солей соединений (b1)-(b46).

Достойны внимания варианты осуществления, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение из каждой из двух различных групп, выбранных из (b1)-(b46).

15 “Метилбензимидазолкарбаматные (МВС) фунгициды (b1)” (FRAC (Международный комитет по резистентности к фунгицидам) код 1) ингибируют митоз посредством связывания с  $\beta$ -тубулином во время сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт внутри клетки и структуру клетки. Метилбензимидазолкарбаматные фунгициды включают

20 бензимидазольные и тиофанатные фунгициды. Бензимидазолы включают беномил, карбендазим, фуберидазол и тиабендазол. Тиофанаты включают тиофанат и тиофанат-метил.

“Дикарбоксимидные фунгициды (b2)” (FRAC код 2), как предполагают, ингибируют перекисное окисление липидов у грибов посредством воздействия на NADH цитохром

25 с редуктазу. Примеры включают хлостолинат, ипродион, процимидон и винклозолин.

“Фунгициды-ингибиторы деметилирования (DMI) (b3)” (FRAC код 3) ингибируют C14-деметилазу, которая играет роль в образовании стеролов. Стерола, такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно,

30 подвергание воздействию этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и, в конечном счете, гибели чувствительных грибов. DMI-фунгициды делят на несколько химических классов: азолы (в том числе триазолы и имидазолы), пиримидины, пиперазины и пиридины. Триазолы включают азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол (в том числе диниконазол-М),

35 эпоксиконазол, этаконазол, фенбуконазол, флуквинконазол, флузилазол, флутриафол, гексаконазол, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, пенконазол, пропиконазол, протиоконазол, квинконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, тритиконазол и униконазол. Имидазолы включают клотримазол, эконазол, имазалил, изоконазол, миконазол, окспоконазол, прохлораз,

40 пефуразоат и трифлумизол. Пиримидины включают фенаримол, нуаримол и триаримол. Пиперазины включают трифорин. Пиридины включают бутиобат и пирифенокс. Биохимические исследования показали, что все из вышеупомянутых фунгицидов представляют собой DMI-фунгициды, как описано К. Н. Kuck с соавт. в *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, Н. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258.

“Фениламидные фунгициды (b4)” (FRAC код 4) представляют собой конкретные ингибиторы РНК-полимеразы у грибов класса оомицетов. Чувствительные грибы, подвергнутые действию данных фунгицидов, показывают пониженную способность

включать уридин в рРНК. Рост и развитие чувствительных грибов не допускают путем подвергания воздействию этого класса фунгицидов. Фениламидные фунгициды включают ацилаланиновые, оксазолидиноновые и бутиролактоновые фунгициды. Ацилаланины включают беналаксил, беналаксил-М, фуралаксил, металаксил, металаксил-М (также известный как мефеноксам). Оксазолидиноны включают оксадиксил. Бутиролактоны включают офурас.

“Амин/морфолиновые фунгициды (b5)” (FRAC код 5) ингибируют два целевых участка в биосинтетическом пути стеролов,  $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$  изомеразу и  $\Delta^{14}$  редуктазу. Стероиды, такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно, подвергание воздействию этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и, в конечном счете, гибели чувствительных грибов. Амин/морфолиновые фунгициды (также известные как не-DMI ингибиторы биосинтеза стерола) включают морфолиновые, пиперидиновые и спирокеталь-аминовые фунгициды. Морфолины включают альдиморф, додеморф, фенпропиморф, тридеморф и триморфамид. Пиперидины включают фенпропидин и пипералин. Спирокеталь-амины включают спироксамин.

“Фунгициды-ингибиторы биосинтеза фосфолипидов (b6)” (FRAC код 6) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез фосфолипидов. Фунгициды, действующие на биосинтез фосфолипидов, включают фосфоротиолатные и дитиолановые фунгициды. Фосфоротиолаты включают эдифенфос, ипробенфос и пиразофос. Дитиоланы включают изопротиолан.

“Карбоксамидные фунгициды (b7)” (FRAC код 7) ингибируют комплекс II (сукцинатдегидрогеназный) дыхания грибов путем разрушения ключевого фермента в цикле Кребса (ЦТК цикл), называемого сукцинатдегидрогеназа. Ингибирование дыхания блокирует в грибе образование АТФ, и таким образом ингибирует рост и размножение. Карбоксамидные фунгициды включают бензамид, фуранкарбоксамид, оксатиинкарбоксамид, тиазолкарбоксамид, пиразолкарбоксамид и пиридинкарбоксамид. Бензамиды включают беноданил, флутоланил и мепронил. Фуранкарбоксамиды включают фенфурам. Оксатиинкарбоксамиды включают карбоксин и оксикарбоксин. Тиазолкарбоксамиды включают тифлузамид. Пиразолкарбоксамиды включают бикафен, фураметпир, изопиразам, флуксапироксад, пентиопирад, седаксан (N-[2-(1S,2R)-[1,1'-бициклопропил]-2-илфенил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид) и пенфлуфен (N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1,3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксамид) (PCT патентная публикация WO 2003/010149).

Пиридинкарбоксамиды включают боскалид.

“Гидрокси(2-амино-)пиримидиновые фунгициды (b8)” (FRAC код 8) ингибируют синтез нуклеиновых кислот посредством воздействия на аденозиндезаминазу. Примеры включают бупиримат, диметиримол и этиримол.

“Анилинопиримидиновые фунгициды (b9)” (FRAC код 9), как предполагают, ингибируют биосинтез аминокислоты метионина и нарушают секрецию гидролитических ферментов, которые лизируют клетки растения во время инфекции. Примеры включают ципродинил, мепанипирим и пириметанил.

“N-фенилкарбаматные фунгициды (b10)” (FRAC код 10) ингибируют митоз посредством связывания с  $\beta$ -тубулином и нарушения сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт внутри клетки и структуру клетки. Примеры включают диэтофенкарб.

“Фунгициды-ингибиторы внешнего хинон-связывающего участка (QoI) (b11)” (FRAC код 11) ингибируют Комплекс III митохондриального дыхания у грибов, воздействуя

на убихинолоксидазу. Окисление убихинола блокируется во “внешнем хинон-связывающем” (Qo) участке цитохром bc1-комплекса, который расположен во внутренней митохондриальной мембране грибов. Ингибирование митохондриального дыхания препятствует нормальному росту и развитию грибов. Фунгициды-ингибиторы внешнего хинон-связывающего участка включают метоксиакрилатные, метоксикарбаматные, оксиминоацетатные, оксиминоацетамидные и дигидродиоксазиновые фунгициды (совместно также известные как стробилуриновые фунгициды) и оксазолидиндионовые, имидазолиноновые и бензилкарбаматные фунгициды. Метоксиакрилаты включают азоксистробин, энестробурин (SYP-Z071) и пикоксистробин. Метоксикарбаматы включают пиракlostробин и пираметостробин. Оксиминоацетаты включают крезоксим-метил, пираоксистробин и трифлостробин. Оксиминоацетамиды включают димоксистробин, метоминостробин, орисастробин и  $\alpha$ -(метоксиимино)-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензолацетамид. Дигидродиоксазины включают флуоксастробин. Оксазолидиндионы включают фамоксадон. Имидазолиноны включают фенамидон. Бензилкарбаматы включают пирибенкарб.

“Фенилпиррольные фунгициды (b12)” (FRAC код 12) ингибируют MAP-протеинкиназу, ассоциированную с осмотической сигнальной трансдукцией у грибов. Фенпиклонил и флудиоксонил являются примерами этого класса фунгицидов.

“Хинолиновые фунгициды (b13)” (FRAC код 13), как предполагают, ингибируют сигнальную трансдукцию, воздействуя на G-белки в ранней передаче сигнала клетки. Как было показано, они воздействуют на прорастание и/или образование аппрессория у грибов, что вызывает настоящую мучнистую росу. Квиноксифен является примером этого класса фунгицидов.

“Фунгициды-ингибиторы перекисного окисления липидов (b14)” (FRAC код 14), как предполагают, ингибируют перекисное окисление липидов, что нарушает у грибов синтез мембраны. Члены этого класса, такие как этридазол, также могут нарушать другие биологические процессы, такие как дыхание и биосинтез меланина. Фунгициды, действующие на перекисное окисление липидов, включают фунгициды на основе ароматических углеводородов и 1,2,4-тиадиазолные фунгициды. Ароматические углеводороды включают бифенил, хлоронеб, диклоран, квинтозен, текназен и толклофос-метил. 1,2,4-Тиадиазолы включают этридазол.

“Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на редуктазу (MBI-R) (b15)” (FRAC код 16.1) ингибируют стадию восстановления нафталя в биосинтезе меланина. Меланин требуется в случае инфекции растения-хозяина некоторыми грибами. Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на редуктазу, включают изобензофураноновые, пирролхинолиноновые и триазолобензотиазоловые фунгициды. Изобензофураноны включают фталид. Пирролхинолиноны включают пироквилон. Триазолобензотиазолы включают трициклазол.

“Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на дегидратазу (MBI-D) (b16)” (FRAC код 16.2) ингибируют ситалондегидратазу в биосинтезе меланина. Меланин требуется в случае инфекции растения-хозяина некоторыми грибами. Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на дегидратазу, включают циклопропанкарбоксамидные, карбоксамидные и пропионамидные фунгициды. Циклопропанкарбоксамиды включают карпропамид. Карбоксамиды включают диклоцимет. Пропионамиды включают феноксанил.

“Гидроксианилидные фунгициды (b17)” (FRAC код 17) ингибируют C4-деметилазу, которая играет роль в образовании стеролов. Примеры включают фенгексамид.

“Фунгициды-ингибиторы сквален-эпоксидазы (b18)” (FRAC код 18) ингибируют сквален-эпоксидазу в пути биосинтеза эргостерола. Стероиды, такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно, подвержение воздействию этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и, в конечном счете, гибели чувствительных грибов. Фунгициды-ингибиторы сквален-эпоксидазы включают тиокарбаматные и аллиламиновые фунгициды. Тиокарбаматы включают пирибутикарб. Аллиламины включают нафтинин и тербинафин.

“Полиоксиновые фунгициды (b19)” (FRAC код 19) ингибируют хитинсинтазу. Примеры включают полиоксин.

“Фенилмочевинные фунгициды (b20)” (FRAC код 20), как предполагают, нарушают клеточное деление. Примеры включают пенцикурон.

“Фунгициды-ингибиторы внутреннего хинон-связывающего участка (QiI) (b21)” (FRAC код 21) ингибируют Комплекс III митохондриального дыхания у грибов, воздействуя на убихинолредуктазу. Восстановление убихинола блокируется во “внутреннем хинон-связывающем” (Qi) участке цитохром bc1-комплекса, который расположен во внутренней митохондриальной мембране грибов. Ингибирование митохондриального дыхания препятствует нормальному росту и развитию грибов.

Фунгициды-ингибиторы внутреннего хинон-связывающего участка включают цианоимидазоловые и сульфамойлтриазоловые фунгициды. Цианоимидазолы включают циазофамид. Сульфамойлтриазолы включают амисулбром.

“Бензамидные фунгициды (b22)” (FRAC код 22) ингибируют митоз посредством связывания с  $\beta$ -тубулином и нарушения сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт внутри клетки и структуру клетки. Примеры включают зоксамид.

“Антибиотические фунгициды на основе енопиранурановой кислоты (b23)” (FRAC код 23) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают бластицидин-S.

“Гексопиранозильные антибиотические фунгициды (b24)” (FRAC код 24) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают касугамицин.

“Глюкопиранозильные антибиотические фунгициды, влияющие на синтез белка (b25)” (FRAC код 25) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают стрептомицин.

“Глюкопиранозильные антибиотические фунгициды, влияющие на трегалазу и биосинтез инозитола (b26)” (FRAC код 26) ингибируют трегалазу в пути биосинтеза инозитола. Примеры включают валидамицин.

“Цианоацетамидоксимовые фунгициды (b27)” (FRAC код 27) включают цимоксанил.

“Карбаматные фунгициды (b28)” (FRAC код 28) рассматривают как ингибиторы роста грибов, действующие на множество участков. Они, как предполагают, воздействуют на синтез жирных кислот в клеточных мембранах, что затем нарушает проницаемость клеточной мембраны. Пропамокарб, иодокарб и протиокарб являются примерами этого класса фунгицидов.

“Фунгициды, разобщающие окислительное фосфорилирование (b29)” (FRAC код 29) ингибируют дыхание грибов посредством разобщения окислительного фосфорилирования. Ингибирование дыхания препятствует нормальному росту и развитию грибов. Этот класс включает 2,6-динитроанилины, такие как флуазинам, пиримидонгидразоны, такие как феримзон, и динитрофенилкротонаты, такие как динокап, мептилдинокап и бинапакрил.

“Фунгициды на основе органических соединений олова (b30)” (FRAC код 30) ингибируют аденозинтрифосфат (АТФ) синтазу в пути окислительного фосфорилирования. Примеры включают фентин ацетат, фентин хлорид и фентин гидроксид.

5 “Фунгициды на основе карбоновых кислот (b31)” (FRAC код 31) ингибируют рост грибов, воздействуя на топоизомеразу дезоксирибонуклеиновой кислоты (ДНК) типа II (гиразу). Примеры включают оксолиновую кислоту.

“Гетероароматические фунгициды (b32)” (FRAC код 32), как предполагают, нарушают синтез ДНК/рибонуклеиновой кислоты (РНК). Гетероароматические фунгициды  
10 включают изоксазолы и изотиазолы. Изоксазолы включают гимексазол, а изотиазолы включают октилинон.

“Фосфонатные фунгициды (b33)” (FRAC код 33) включают фосфористую кислоту и ее различные соли, в том числе фосетил-алюминий.

“Фунгициды на основе фталамовой кислоты (b34)” (FRAC код 34) включают  
15 теклофталам.

“Бензотриазинные фунгициды (b35)” (FRAC код 35) включают триазоксид.

“Бензол-сульфонамидные фунгициды (b36)” (FRAC код 36) включают флусульфамид.

“Пиридазиновые фунгициды (b37)” (FRAC код 37) включают дикломезин.

“Тиофен-карбоксамидные фунгициды (b38)” (FRAC код 38), как предполагают,  
20 нарушают образование АТФ. Примеры включают силтиофам.

“Пиримидинамидные фунгициды (b39)” (FRAC код 39) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез фосфолипидов, и включают дифлуметорим.

“Фунгициды на основе амидов карбоновых кислот (САА) (b40)” (FRAC код 40), как предполагают, ингибируют биосинтез фосфолипидов и образование клеточной стенки.  
25 Ингибирование этих процессов препятствует росту и приводит к гибели целевого гриба.

Фунгициды на основе амидов карбоновых кислот включают фунгициды на основе амидов коричной кислоты, валинамидкарбаматные фунгициды и фунгициды на основе амидов миндальной кислоты. Амиды коричной кислоты включают диметоморф и флуморф. Валинамидкарбаматы включают бентиаваликарб, бентиаваликарб-изопропил,  
30 ипроваликарб и валифеналат (валифенал). Амиды миндальной кислоты включают мандипропамид, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид и N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид.

“Тетрациклиновые антибиотические фунгициды (b41)” (FRAC код 41) ингибируют  
35 рост грибов, воздействуя на комплекс 1 никотинамидадениндинуклеотид (NADH) оксидоредуктазы. Примеры включают окситетрациклин.

“Тиокарбаматные фунгициды (b42)” (FRAC код 42) включают метасульфокарб.

“Бензамидные фунгициды (b43)” (FRAC код 43) ингибируют рост грибов посредством  
40 делокализации спектрин-подобных белков. Примеры включают ацилпиколидные фунгициды, такие как флуопиколид и флуопирам.

“Фунгициды для индукции защиты растения-хозяина (b44)” (FRAC код P) индуцируют защитные механизмы растения-хозяина. Фунгициды для индукции защиты растения-хозяина включают бензо-тиадиазольные, бензизотиазолные и тиадиазол-карбоксамидные фунгициды. Бензо-тиадиазолы включают ацибензолар-S-метил.  
45 Бензизотиазолы включают пробеназол. Тиадиазол-карбоксамиды включают тиадинил и изотианил.

“Фунгициды с контактной активностью, действующие на множество участков (b45)” ингибируют рост грибов через множественные участки приложения действия и обладают

контактной/профилактической активностью. Этот класс фунгицидов включает:

“фунгициды на основе меди (b45.1) (FRAC код M1)”, “фунгициды на основе серы (b45.2) (FRAC код M2)”, “дитиокарбаматные фунгициды (b45.3) (FRAC код M3)”, “фталимидные фунгициды (b45.4) (FRAC код M4)”, “хлорнитрильные фунгициды (b45.5) (FRAC код M5)”, “сульфамидные фунгициды (b45.6) (FRAC код M6)”, “гуанидиновые фунгициды (b45.7) (FRAC код M7)” “триазиновые фунгициды (b45.8) (FRAC код M8)” и “хиноновые фунгициды (b45.9) (FRAC код M9)”. “Фунгициды на основе меди” представляют собой неорганические соединения, содержащие медь, как правило, в окисленном состоянии медь(II); примеры включают оксихлорид меди, сульфат меди и гидроксид меди, в том числе композиции, такие как бордоская смесь (трехосновный сульфат меди). “Фунгициды на основе серы” представляют собой неорганические химические вещества, содержащие кольца или цепи из атомов серы; примеры включают элементарную серу.

“Дитиокарбаматные фунгициды” содержат фрагмент молекулы дитиокарбамата; примеры включают манкозеп, метирам, пропинеб, фербам, манеб, тирам, цинеб и цирам.

“Фталиимидные фунгициды” содержат фрагмент молекулы фталиимида; примеры включают фолпет, каптан и каптафол. “Хлорнитрильные фунгициды” содержат замещенные хлором и циано ароматические кольца; примеры включают хлороталонил.

“Сульфамидные фунгициды” включают дихлофлуанид и толлфлуанид. “Гуанидиновые фунгициды” включают додин, гуазатин и иминоктадин. “Триазиновые фунгициды”

включают анилазин. “Хиноновые фунгициды” включают дитианон.

“Иные фунгициды, чем фунгициды из компонента (a) и компонентов (b1)-(b45); (b46)” включают определенные фунгициды, чей механизм действия может быть неизвестен.

Они включают: (b46.1) “тиазолкарбоксамидные фунгициды” (FRAC код U5), (b46.2) “фенил-ацетамидные фунгициды” (FRAC код U6), (b46.3) “хиназолиновые фунгициды”

(FRAC код U7), (b46.4) “бензофеноновые фунгициды” (FRAC код U8) и (b46.5)

“триазолопиримидиламиновые фунгициды” (FRAC код 45). Тиазолкарбоксамиды

включают этабоксам. Фенил-ацетамиды включают цифлуфенамид и N-[[

(циклопропилметокси)амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]-метиле

бензолацетамид. Хиназолиноны включают проквиназид и 2-бутокси-6-иодо-3-пропил-

4H-1-бензопиран-4-он. Бензофеноны включают метрафенон и пириофенон.

Триазолопиримидиламины включают аметоктрадин и, как полагают, ингибируют Комплекс III митохондриального дыхания посредством связывания с невыявленным участком на убихинон-цитохром bc1-редуктазе. Класс (b46) также включает бетоксазин,

нео-азозин (метанарсонат трехвалентного железа), фенпиразамин, пирролнитрин,

хинометионат, тебуфлоквин, 2-[[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]тио]-2-[3-(2-

метоксифенил)-2-тиазолидинилиден]ацетонитрил, 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-

изоксазолидинил]пиридин, 4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил

пропил]карбамат, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]

триазоло[1,5-а]пиримидин, N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-метилбензолсульфонамид,

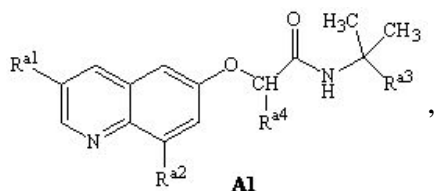
N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)феноксид]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-

метилметанимидамид и 1-[(2-пропенилтио)карбонил]-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)

-5-амино-1H-пиразол-3-он.

“Иные фунгициды, чем фунгициды из компонента (a) и компонентов (b1)-(b45); (b46)” также включают (b46.5) 6-хинолинилоксиацетамидные соединения формулы A1 и их

соли



где

$R^{a1}$  представляет собой галоген,  $C_1$ - $C_4$ алкокси или  $C_1$ - $C_4$ алкинил;

$R^{a2}$  представляет собой H, галоген или  $C_1$ - $C_4$ алкил;

10  $R^{a3}$  представляет собой  $C_1$ - $C_{12}$ алкил,  $C_1$ - $C_{12}$ галогеналкил,  $C_1$ - $C_{12}$ алкокси,  $C_2$ - $C_{12}$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_{12}$ алкенил,  $C_2$ - $C_{12}$ алкинил,  $C_4$ - $C_{12}$ алкоксиалкенил,  $C_4$ - $C_{12}$ алкоксиалкинил,  $C_1$ - $C_{12}$ алкилтио или  $C_2$ - $C_{12}$ алкилтиоалкил;

15  $R^{a4}$  представляет собой метил или  $Y^{a1}$ - $R^{a5}$ ;

$R^{a5}$  представляет собой  $C_1$ - $C_2$ алкил; и

$Y^{a1}$  представляет собой  $CH_2$ , O или S.

20 Широко известные соединения формулы A1, их применение в качестве фунгицидов и способы получения; см., например, РСТ патентные публикации WO 2004/047538, WO 2004/108663, WO 2006/058699, WO 2006/058700, WO 2008/110355, WO 2009/030469, WO 2009/049716 и WO 2009/087098. Примеры соединений формулы A1 включают: 2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид, N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамид, 2-[(3-бром-8-метил-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-пропин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид и 2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметилэтил)бутанамид.

25 “Иные фунгициды, чем фунгициды из компонента (a) и компонентов (b1)-(b45); (b46)” также включают (b46.6) N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-триадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид, который, как полагают, ингибирует  $C_{24}$ -метилтрансферазу, вовлеченную в биосинтез стеролов.

30 В вариантах осуществления настоящего изобретения, в том числе описываемых ниже, ссылка на формулу 1 включает ее N-оксиды и соли, если не указывается иное, и ссылка на “соединение формулы 1” включает определения заместителей, указанных в кратком описании настоящего изобретения, за исключением случаев, дополнительно определенных в вариантах осуществления.

Вариант осуществления 1. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения, где в формуле 1 X представляет собой СНОН или NH.

40 Вариант осуществления 2. Композиция по варианту осуществления 1, где X представляет собой СНОН.

Вариант осуществления 3. Композиция по варианту осуществления 1, где X представляет собой NH.

45 Вариант осуществления 4. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-3, где в формуле 1  $R_1$  представляет собой галоген.

Вариант осуществления 5. Композиция по варианту осуществления 4, где  $R^1$  представляет собой F, Cl или Br.

Вариант осуществления 6. Композиция по варианту осуществления 5, где  $R^1$

представляет собой Cl или Br.

Вариант осуществления 7. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-6, где в формуле 1  $R^2$  представляет собой H, циано, F, Cl, Br или  $C_1$ - $C_2$ алкокси.

Вариант осуществления 8. Композиция по варианту осуществления 7, где  $R^2$  представляет собой H, циано, F, Cl, Br или метокси.

Вариант осуществления 9. Композиция по варианту осуществления 8, где  $R^2$  представляет собой циано, F, Cl или метокси.

Вариант осуществления 10. Композиция по варианту осуществления 9, где  $R^2$  представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 11. Композиция по варианту осуществления 8, где  $R^2$  представляет собой H.

Вариант осуществления 12. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-11, где в формуле 1  $R^3$  представляет собой H или галоген.

Вариант осуществления 13. Композиция по варианту осуществления 12, где  $R^3$  представляет собой H, F, Cl или Br.

Вариант осуществления 14. Композиция по варианту осуществления 13, где  $R^3$  представляет собой H, F или Cl.

Вариант осуществления 15. Композиция по варианту осуществления 14, где  $R^3$  представляет собой H или F.

Вариант осуществления 16. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-11, где в формуле 1  $R^3$  представляет собой галоген или метил.

Вариант осуществления 17. Композиция по варианту осуществления 16, где  $R^3$  представляет собой галоген.

Вариант осуществления 18. Композиция по варианту осуществления 17, где  $R^3$  представляет собой F, Cl или Br.

Вариант осуществления 19. Композиция по варианту осуществления 14 или 18, где  $R^3$  представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 20. Композиция по варианту осуществления 15 или 19, где  $R^3$  представляет собой F.

Вариант осуществления 21. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-20, где в формуле 1  $R^4$  представляет собой F, Cl или Br.

Вариант осуществления 22. Композиция по варианту осуществления 21, где  $R^4$  представляет собой Cl или Br.

Вариант осуществления 23. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-22, где в формуле 1  $R^5$  представляет собой H, циано, F, Cl, Br или  $C_1$ - $C_2$ алкокси.

Вариант осуществления 24. Композиция по варианту осуществления 23, где  $R^5$  представляет собой H, циано, F, Cl или метокси.

Вариант осуществления 25. Композиция по варианту осуществления 24, где  $R^5$  представляет собой циано, F, Cl или метокси.

Вариант осуществления 26. Композиция по варианту осуществления 25, где  $R^5$  представляет собой циано или F.

Вариант осуществления 27. Композиция по варианту осуществления 26, где  $R^5$  представляет собой циано.

Вариант осуществления 28. Композиция по варианту осуществления 26, где  $R^5$  представляет собой F.

Вариант осуществления 29. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-28, где в формуле 1  $R^6$  представляет собой H, F, Cl или Br.

Вариант осуществления 30. Композиция по варианту осуществления 29, где  $R^6$  представляет собой H или F.

Вариант осуществления 31. Композиция по варианту осуществления 30, где  $R^6$  представляет собой H.

Вариант осуществления 32. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-31, где в формуле 1 чаще всего только один из  $R^2$  и  $R^3$  представляет собой H (т.е. только один из  $R^2$  и  $R^3$  представляет собой H, или ни  $R^2$ , ни  $R^3$  не является H).

Вариант осуществления 33. Композиция по варианту осуществления 32, где  $R^3$  представляет собой H (и  $R^2$  является иным, чем H).

Вариант осуществления 34. Композиция по варианту осуществления 32, где  $R^2$  представляет собой H (и  $R^3$  является иным, чем H).

Вариант осуществления 35. Композиция по варианту осуществления 32, где как  $R^2$ , так и  $R^3$  являются иными, чем H.

Вариант осуществления 36. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-35, где в формуле 1 чаще всего только один из  $R^5$  и  $R^6$  представляет собой H (т.е. только один из  $R^5$  и  $R^6$  представляет собой H, или ни  $R^5$ , ни  $R^6$  не является H).

Вариант осуществления 37. Композиция по варианту осуществления 36, где  $R^6$  представляет собой H (и  $R^5$  является иным, чем H).

Вариант осуществления 38. Композиция по варианту осуществления 36, где  $R^5$  представляет собой H (и  $R^6$  является иным, чем H).

Вариант осуществления 39. Композиция по варианту осуществления 36, где как  $R^5$ , так и  $R^6$  являются иными, чем H.

Вариант осуществления 40. Композиция, содержащая компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-39, где в формуле 1 чаще всего только два из  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$  представляют собой H.

Вариант осуществления 41. Композиция по варианту осуществления 40, где два из  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$  представляют собой H.

Вариант осуществления 42. Композиция по варианту осуществления 40, где чаще всего только один из  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$  представляет собой Н.

Вариант осуществления 43. Композиция по варианту осуществления 42, где один из  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$  представляет собой Н.

Вариант осуществления 44. Композиция, содержащая компоненты (а) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-43, где компонент (а) не включает N-оксид соединения формулы 1.

Вариант осуществления 45. Композиция, содержащая компоненты (а) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-44, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из:

N,4-бис(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 47),

N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 143),

N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2-бром-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 195),

N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 144),

N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 81),

4-[5-[(4-хлор-2-фторфенил)амино]-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-ил]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 40),

N-(2-хлор-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 82),

4-[5-[(2-хлор-4,6-дифторфенил)амино]-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-ил]-3-фторбензонитрила (соединение 238),

4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 13),

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,4-дихлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 136),

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 3),

4-(2-хлор-4-фторфенил)- $\alpha$ -(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-метанола (соединение 122),

N-(2,4-дихлор-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 161),

4-(2,4-дихлорфенил)-N-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 17),

4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-амин (соединение 7),

4-[[1,3-диметил-4-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 8),

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 239),

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 240),

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 241),

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин

- (соединение 244),  
N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 245),  
N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
5 (соединение 247),  
4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-фтор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 252),  
4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 253),  
10 N-(2-бром-6-метилфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 254),  
N-(2-хлор-6-метилфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-  
амина (соединение 257),  
N-(2-бром-6-метилфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-  
15 амина (соединение 258),  
4-(2-фтор-4-метоксифенил)-N-(2-фтор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-  
амина (соединение 259),  
N-(2-хлор-6-фторфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 260),  
20 N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 261),  
4-(2-хлор-4-метоксифенил)-N-(2-хлор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 262),  
N-(2-бром-6-метилфенил)-4-(2-хлор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-  
25 амина (соединение 263),  
N-(2-бром-6-метилфенил)-4-(2-хлор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-  
амина (соединение 264),  
N-(2-бром-6-метилфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 265),  
30 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 266),  
4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-фтор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 267),  
4-(2,4-дифторфенил)-N-(2-фтор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
35 (соединение 268),  
N-(2-хлор-6-метилфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 269),  
4-(2,4-дифторфенил)-N-(2,6-диметилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 270),  
40 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-диметилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 271),  
N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 273),  
N-(2-хлор-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
45 (соединение 275) и  
4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-метилфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина  
(соединение 276)  
(при условии, что соединения группы находятся в объеме основного варианта

осуществления).

Вариант осуществления 46. Композиция по варианту осуществления 45, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединений 3, 7, 8, 13, 17, 40, 47, 81, 82, 122, 136, 143, 144, 161, 195, 238, 239, 240 и 241.

5 Вариант осуществления 47. Композиция по варианту осуществления 46, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединений 3, 7, 8, 13, 17, 40, 47, 81, 82, 122, 136, 143, 144, 161, 195 и 238.

Вариант осуществления 48. Композиция по варианту осуществления 45, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединений 239, 240, 241, 10 244, 245, 247, 252, 253, 254, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 273, 275 и 276.

Вариант осуществления 49. Композиция по варианту осуществления 48, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединений 239, 240 и 241.

15 Вариант осуществления 50. Композиция по варианту осуществления 45, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединения 195 и соединения 238.

Вариант осуществления 51. Композиция, содержащая компоненты (а) и (б), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 20 1-50, при условии, если компонент (а) состоит из соединения, выбранного из группы, состоящей из:

4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-амин (соединение 4),

4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-N-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 6),

4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-амин (соединение 7),

4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-амин (соединение 11),

30 4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 13),

4-[[4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3-фторбензонитрила (соединение 130),

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 46),

4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3-фторбензонитрила (соединение 33),

3-хлор-4-[[4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]бензонитрила (соединение 127),

40 4-(2-хлор-4-фторфенил)- $\alpha$ -(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-метанола (соединение 122),

N,4-бис(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 47),

N-(2-хлор-4-фторфенил)-4-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 58),

45 N-(2-хлор-4,6-дифторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 86),

N-(2-хлор-4,6-дифторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин (соединение 117),

- N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 121),
- N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 126),
- 5 3-хлор-4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]бензонитрила (соединение 37),
- 4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]амино]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 25),
- N-(2-хлор-4-фторфенил)-4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 23),
- 10 α,4-бис(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-метанола (соединение 123),
- N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 81),
- N-(2-хлор-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 82),
- 15 N-(2,6-дихлор-4-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 137),
- 3-хлор-4-[5-[(2-хлор-4,6-дифторфенил)амино]-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-ил]бензонитрила (соединение 108),
- 20 3-хлор-4-[5-[(4-хлор-2,6-дифторфенил)амино]-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-ил]бензонитрила (соединение 111),
- N-(2-бром-4-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 118),
- 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,4-дихлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 136),
- 25 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дихлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 138),
- 4-[[4-(2-бром-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3-фторбензонитрила (соединение 79),
- 30 N-(2-бром-4-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 73),
- 4-(2-бром-4-фторфенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1Н-пиразол-5-амина (соединение 74),
- N-(4-бром-2,6-дифторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 133),
- 35 4-[[4-(2-бром-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 65),
- 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-4,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 84),
- 40 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 129),
- N-(4-бром-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина (соединение 134),
- 3-бром-4-[[4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]бензонитрила (соединение 139),
- 45 3-хлор-4-[[4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-ил]окси]бензонитрила (соединение 140),
- N-(2,4-дихлор-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амина

(соединение 141),

N-(2,6-дихлор-4-фторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 142),

5 N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 143),

N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 144),

N-(4-бром-2,6-дифторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 145),

10 N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 146),

N-(2-бром-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 147),

15  $\alpha$ -(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-метанола (соединение 148),

4-[5-[(2-хлор-4,6-дифторфенил)амино]-1,3-диметил-1H-пиразол-4-ил]-3-фторбензонитрила (соединение 238),

4-[5-[(4-хлор-2,6-дифторфенил)амино]-1,3-диметил-1H-пиразол-4-ил]-3-фторбензонитрила (соединение 150),

20  $\alpha$ -(2-хлор-4,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-метанола (соединение 151),

$\alpha$ -(2-бром-4-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-метанола (соединение 152) и

25  $\alpha$ -(2-бром-4-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-метанола (соединение 153),

тогда компонент (b) содержит по меньшей мере два фунгицидных соединения, и

(1) если компонент (b) состоит из двухкомпонентной комбинации из двух фунгицидных соединений, где одно из фунгицидных соединений представляет собой ципроконазол, дифеноконазол, эпоксиконазол, метконазол, миклобутанил, протиоконазол или тебуконазол, тогда другое фунгицидное соединение является иным, чем азоксистробин, биксафен, боскалид, цифлуфенамид, флуопирам, изопиразам, крезоксим-метил, метрафенон, пентиопирад, пикоксистробин, проквиназид, пиракlostробин, квиноксифен, седаксан или трифлуксистробин, и

(2) если компонент (b) состоит из трехкомпонентной комбинации из трех фунгицидных соединений, где одно из фунгицидных соединений представляет собой ципроконазол, дифеноконазол, эпоксиконазол, метконазол, миклобутанил, протиоконазол или тебуконазол, и еще одно из фунгицидных соединений представляет собой пикоксистробин или трифлуксистробин, тогда третье фунгицидное соединение представляет собой иное, чем проквиназид.

40 Варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе варианты осуществления 1-51 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, могут комбинироваться любым способом, и описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к композициям, содержащим соединения формулы 1 по меньшей мере с одним другим фунгицидным соединением, но также к композициям, содержащим соединения формулы 1 по меньшей мере с одним соединением или средством для контроля беспозвоночных вредителей, также к соединениям формулы 1 и их композициям, а также к исходным соединениям и промежуточным соединениям, применяемым для получения соединений формулы 1. Кроме того, варианты

осуществления настоящего изобретения, в том числе варианты осуществления 1-51 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, и их любая комбинация, относятся к способам настоящего изобретения. Следовательно, следует отметить в качестве дополнительного варианта осуществления раскрытую выше композицию, содержащую (а) по меньшей мере одно соединение, выбранное из соединений формулы 1, описанной выше, их N-оксидов и солей; и по меньшей мере одно соединение или средство для контроля беспозвоночных вредителей при условии, что если компонент (а) состоит из соединения, выбранного из группы, перечисленной в варианте осуществления 51, тогда композиция содержит по меньшей мере два соединения или средства для контроля беспозвоночных вредителей или по меньшей мере одно дополнительное фунгицидное соединение (т.е. фунгицидное соединение в дополнение к соединению формулы 1).

Комбинации вариантов осуществления 1-51 иллюстрируются при помощи следующего:

15 Вариант осуществления А1. Композиция, содержащая компоненты (а) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения, где компонент (а) включает соединение формулы 1 или его соль, где в формуле 1

чаще всего только один из  $R^2$  и  $R^3$  представляет собой H; и

20 чаще всего только один из  $R^5$  и  $R^6$  представляет собой H.

Вариант осуществления А2. Композиция по варианту осуществления А1, где в формуле 1

$R^1$  представляет собой F, Cl или Br;

25  $R^2$  представляет собой H, циано, F, Cl, Br или метокси;

$R^3$  представляет собой H, F или Cl;

$R^4$  представляет собой F, Cl или Br;

$R^5$  представляет собой H, циано, F, Cl или метокси; и

30  $R^6$  представляет собой H или F.

Вариант осуществления А3. Композиция по варианту осуществления А2, где в формуле 1

$R^3$  представляет собой H или F; и

$R^5$  представляет собой циано, F, Cl или метокси.

35 Вариант осуществления А4. Композиция по варианту осуществления А3, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединения 3, соединения 7, соединения 8, соединения 13, соединения 17, соединения 40, соединения 47, соединения 81, соединения 82, соединения 122, соединения 136, соединения 143, соединения 144, соединения 161, соединения 195, соединения 238, соединения 239, 40 соединения 240 и соединения 241.

Вариант осуществления А5. Композиция по варианту осуществления А4, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединения 3, соединения 7, соединения 8, соединения 13, соединения 17, соединения 40, соединения 47, соединения 81, соединения 82, соединения 122, соединения 136, соединения 143, 45 соединения 144, соединения 161, соединения 195 и соединения 238.

Вариант осуществления А6. Композиция, содержащая компоненты (а) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения, где компонент (а) включает соединение формулы 1 или его соль, где в формуле 1

X представляет собой NH;

R<sup>1</sup> представляет собой галоген или метил;

R<sup>2</sup> представляет собой H;

5 R<sup>3</sup> представляет собой галоген или метил;

R<sup>4</sup> представляет собой галоген;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и

10 R<sup>6</sup> представляет собой H или галоген;

при условии, что если R<sup>1</sup> представляет собой F, то R<sup>3</sup> представляет собой Cl, и если R<sup>1</sup> представляет собой Cl, то R<sup>3</sup> представляет собой F.

Вариант осуществления A7. Композиция по варианту осуществления A6, где в формуле 1

15 R<sup>3</sup> представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления A8. Композиция по варианту осуществления A7, где в формуле 1

R<sup>1</sup> представляет собой Cl или Br; и

20 R<sup>3</sup> представляет собой F.

Вариант осуществления A9. Композиция по любому из вариантов осуществления A6-A8, где в формуле 1, чаще всего, только один из R5 и R6 представляет собой H.

Вариант осуществления A10. Композиция по варианту осуществления A9, где в формуле 1

25 R<sup>4</sup> представляет собой F, Cl или Br;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, F, Cl или метокси; и

R<sup>6</sup> представляет собой H или F.

30 Вариант осуществления A11. Композиция по варианту осуществления A10, где в формуле 1

R<sup>5</sup> представляет собой циано, F, Cl или метокси.

Вариант осуществления A12. Композиция по варианту осуществления A6, где компонент (a) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из соединения 239, соединения 240 и соединения 241.

35 Вариант осуществления B1. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b1) метилбензимидазолкарбаматных фунгицидов, таких как беномил, карбендазим и тиофанат-метил.

40 Вариант осуществления B2. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b2) дикарбоксимидных фунгицидов, таких как процимидон, ипродион и винклозолин.

45 Вариант осуществления B3. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b3) фунгицидов-ингибиторов деметилирования, таких как

эпоксиконазол, флуквинконазол, триадименол, симеконазол, ипконазол, трифорин, ципроконазол, дифенокконазол, флузилазол, флутриафол, метконазол, миклобутанил, прохлораз, пропиконазол, протиоконазол, тебуконазол и тетраконазол.

5        Вариант осуществления В4. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b4) фениламидных фунгицидов, таких как металаксил, металаксил-М, беналаксил, беналаксил-М, фуралаксил, офурас и оксациксил.

10        Вариант осуществления В5. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b5) амин/морфолиновых фунгицидов, таких как альдиморф, додеморф, фенпропиморф, тридеморф, триморфамид, фенпропидин, пипералин и спироксамин.

15        Вариант осуществления В6. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b6) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза фосфолипидов, таких как эдифенфос и изопротиолан.

20        Вариант осуществления В7. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b7) карбоксамидных фунгицидов, таких как биксафен, боскалид, карбоксин, изопиразам, оксикарбоксин, пенфлуфен и пентиопирад.

25        Вариант осуществления В8. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b8) гидроксид(2-амино-)пиримидиновых фунгицидов, таких как этиримол.

30        Вариант осуществления В9. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b9) анилинопиримидиновых фунгицидов, таких как ципродинил.

35        Вариант осуществления В10. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b10) N-фенилкарбаматных фунгицидов, таких как диэтофенкарб.

40        Вариант осуществления В11. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинон-связывающего участка, таких как азоксистробин, пиракlostробин, пираметостробин, крезоксим-метил, 45        трифлуксистробин, пикоксистробин, пираоксистробин, пирибенкарб, фамоксадон, фенамидон, дискостробин, энеостробин, димоксистробин, метоминоостробин, орисаостробин и флуоксаостробин.

Вариант осуществления В12. Композиция, описанная в кратком описании настоящего

изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b12) соединения фенилпиррольных фунгицидов, таких как фенпиклонил и флудиоксонил.

5       Вариант осуществления B13. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b13) хинолиновых фунгицидов, таких как квиноксифен.

10       Вариант осуществления B14. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b14) фунгицидов-ингибиторов перекисного окисления липидов, таких как хлоронеб.

15       Вариант осуществления B15. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b15) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на редуктазу, таких как пироквилон и трициклазол.

20       Вариант осуществления B16. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b16) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на дегидратазу, таких как карпропамид.

25       Вариант осуществления B17. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b17) гидроксанилидных фунгицидов, таких как фенгексамид.

30       Вариант осуществления B18. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b18) фунгицидов-ингибиторов сквален-эпоксидазы, таких как пирибутикарб.

35       Вариант осуществления B19. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b19) полиоксиновых фунгицидов, таких как полиоксин.

40       Вариант осуществления B20. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b20) фенилмочевинных фунгицидов, таких как пенцикурон.

45       Вариант осуществления B21. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b21) фунгицидов-ингибиторов внутреннего хинон-связывающего участка, таких как циазофамид и амисулбром.

Вариант осуществления B22. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

соединение, выбранное из (b22) бензамидных фунгицидов, таких как зоксамид.

5 Вариант осуществления В23. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b23) антибиотических фунгицидов на основе

10 енопиранурановой кислоты, таких как бластицидин-S.

Вариант осуществления В24. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

10 соединение, выбранное из (b24) гексопиранозильных антибиотических фунгицидов, таких как касугамицин.

Вариант осуществления В25. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

15 соединение, выбранное из (b25) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на синтез белка, таких как стрептомицин.

Вариант осуществления В26. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

20 соединение, выбранное из (b26) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на трегалазу и биосинтез инозитола, таких как валидамицин.

Вариант осуществления В27. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

25 соединение, выбранное из (b27) цианоацетамидоксимовых фунгицидов, таких как цимоксанил.

Вариант осуществления В28. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

30 соединение, выбранное из (b28) карбаматных фунгицидов, таких как пропамокарб, протиокарб и иодокарб.

Вариант осуществления В29. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

35 соединение, выбранное из (b29) фунгицидов, разобщающих окислительное фосфорилирование, таких как флуазинам, бинапакрил, феримзон, мептилдинокап и динокап.

Вариант осуществления В30. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

40 соединение, выбранное из (b30) фунгицидов на основе органических соединений олова, таких как фентин ацетат.

Вариант осуществления В31. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно

45 соединение, выбранное из (b31) фунгицидов на основе карбоновых кислот, таких как оксолиновая кислота.

Вариант осуществления В32. Композиция, описанная в кратком описании настоящего

изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b32) гетероароматических фунгицидов, таких как гимексазол.

5 Вариант осуществления В33. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b33) фосфонатных фунгицидов, таких как фосфористая кислота и ее различные соли, в том числе фосетил-алюминий.

10 Вариант осуществления В34. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b34) фунгицидов на основе фталамовой кислоты, таких как теклофталам.

15 Вариант осуществления В35. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b35) бензотриазиновых фунгицидов, таких как триазоксид.

20 Вариант осуществления В36. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b36) бензол-сульфонамидных фунгицидов, таких как флусульфамид.

25 Вариант осуществления В37. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b37) пиридазиновых фунгицидов, таких как дикломезин.

30 Вариант осуществления В38. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b38) тиофен-карбоксамидных фунгицидов, таких как силтиофам.

35 Вариант осуществления В39. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b39) пиримидинамидных фунгицидов, таких как дифлуметорим.

40 Вариант осуществления В40. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b40) фунгицидов на основе амидов карбоновых кислот, таких как диметоморф, бентиаваликарб, бентиаваликарб-изопропил, ипроваликарб, валифеналат, мандипропамид и флуморф.

45 Вариант осуществления В41. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и A1-A12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b41) тетрациклиновых антибиотических фунгицидов, таких как окситетрациклин.

Вариант осуществления В42. Композиция, описанная в кратком описании настоящего

изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b42) тиакарбаматных фунгицидов, таких как метасульфокарб.

5 Вариант осуществления В43. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b43) бензамидных фунгицидов, таких как флуопиколид и флуопирам.

10 Вариант осуществления В44. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b44) фунгицидов для индукции защиты растения-хозяина, таких как ацибензолар-S-метил.

15 Вариант осуществления В45. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b45) контактных фунгицидов с множественными участками, таких как оксихлорид меди, сульфат меди, гидроксид меди, бордосская смесь (трехосновный сульфид меди), элементарная сера, манкозеп, метирам, пропинеб, фербам, манеб, тирам, цинеб, цирам, фолпет, каптан, каптафол и хлороталонил.

20 Вариант осуществления В46. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из (b46) иных фунгицидов, чем фунгициды из компонента (a) и 25 компонентов (b1)-(b45), таких как этабоксам, цифлуфенамид, проквиназид, метрафенон, пириофенон, аметоктрадин, бетоксазин, нео-азозин, фенпиразамин, пирролнитрин, хинометионат, тебуфлоквин, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил) [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин (BAS600), 2-бутоксид-6-иодо-3-пропил-4Н-1-бензопиран-4-он, 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил]пиридин (SYP-Z048), 4- 30 фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат (XR-539), N-[[циклопропилметокси]амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил] бензолацетамид, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)феноксид]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид, 2-[[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]тио]-2-[3-(2-метоксифенил)-2-тиазолидинилиден]ацетонитрил (OK-5203), N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4- 35 метилбензолсульфонамид (TF-991) и 1-[(2-пропенилтио)карбонил]-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-5-амино-1Н-пиразол-3-он.

40 Вариант осуществления В47. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение (фунгицид), выбранное из группы, состоящей из азоксистробина, крезоксим-метила, трифлорсистробина, пиракlostробина, пираоксистробина, пираметостробина, пикоксистробина, димоксистробина, метоминостробина/феноминостробина, карбендазима, хлороталонила, квиноксифена, метрафенона, пириофенона, цифлуфенамида, фенпропидина, фенпропиморфа, 45 бромуконазола, ципроконазола, дифеноконазола, эпоксиконазола, фенбуконазола, флузилазола, гексаконазола, ипконазола, метконазола, миклобутанила, пенконазола, пропиконазола, проквиназида, протиокконазола, тебуконазола, тритиконазола, фамоксадона, прохлораза, пентиопирада и боскалида (никобифен).

Вариант осуществления В48. Композиция по варианту осуществления В47, где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из группы, состоящей из азоксистробина, крезоксим-метила, трифлуксистробина, пиракlostробина, пираметостробина, пираоксистробина, пикоксистробина, димоксистробина, метоминостробина/феноминостробина, квиноксифена, метрафенона, пириофенона, 5 цифлуфенамида, фенпропицина, фенпропиморфа, ципроконазола, дифеноконазола, эпоксиконазола, флузилазола, метконазола, миклобутанила, пропиконазола, проквиназида, протиоконазола, тебуконазола, тритиконазола, фамоксадона и пентиопирада.

10 Вариант осуществления В49. Композиция, описанная в кратком описании настоящего изобретения (в том числе без ограничения композиция по любому из вариантов осуществления 1-51 и А1-А12), где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из соединений формулы А1 и их солей, где формула А1 и заместители на ней такие, как раскрыто в данном документе для класса (b46.5) 6-15 хинолинилоксиацетамидных соединений.

Вариант осуществления В50. Композиция по варианту осуществления В49, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из 2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамида, N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамида, 2-[(3-бром-8-метил-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-пропин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамида и 2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметилэтил)бутанамида.

Следует отметить композицию по любому из вариантов осуществления, описанных в данном документе, в том числе вариантов осуществления 1-51, А1-А12 и В1-В50, где 25 ссылка на формулу 1 включает ее соли, но не ее N-оксиды; следовательно, фразу “соединение формулы 1” можно заменить фразой “соединение формулы 1 или его соль”. В этой композиции, которую следует отметить, компонент (a) включает соединение формулы 1 или его соль.

Также достойными внимания в качестве вариантов осуществления являются 30 фунгицидные композиции настоящего изобретения, содержащие фунгицидно эффективное количество композиции по вариантам осуществления 1-51, А1-А12 и В1-В50 и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

35 Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают способы контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, включающие нанесение на растение или его часть, или на семя растения, или сеянец фунгицидно эффективного количества композиции по любому из вариантов осуществления 1-51, А1-А12 и В1-В50 (например, в качестве композиции, включающей ингредиенты состава, 40 как описано в данном документе). Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающие нанесение фунгицидно эффективного количества композиции по любому из вариантов осуществления 1-51, А1-А12 и В1-В50 на растение или семя растения.

45 Некоторые варианты осуществления настоящего изобретения включают контроль болезни растения или защиту от болезни растения, которая в первую очередь поражает листву растения, и/или нанесение композиции настоящего изобретения на листву растения (т.е. на растение вместо семян). Предпочтительные способы применения

включают таковые, вовлекающие вышеуказанные предпочтительные композиции; и болезни, контролируемые с конкретной эффективностью, включают болезни растений, вызванные патогенными грибами растений. Комбинации фунгицидов, применяемые в соответствии с настоящим изобретением, могут облегчать контроль болезней и

5 задерживать развитие резистентности.

Варианты осуществления способа дополнительно включают:

Вариант осуществления С1. Способ защиты растения от болезни, выбранной из настоящей мучнистой росы, ржавчины и болезней, вызываемых *Septoria*, включающий нанесение на растение фунгицидно эффективного количества композиции, содержащей

10 компоненты (a) и (b), описанные в кратком описании настоящего изобретения или любом из вариантов осуществления 1-51.

Вариант осуществления С2. Способ по варианту осуществления С1, где болезнь представляет собой настоящую мучнистую росу и компонент (b) композиции включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из (b4) фунгицидов-

15 ингибиторов деметилирования (DMI), (b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинин-связывающего участка (QoI) и (b46.4) проквиназида.

Вариант осуществления С3. Способ по варианту осуществления С2, где болезнь представляет собой настоящую мучнистую росу пшеницы.

Вариант осуществления С4. Способ по варианту осуществления С2 или С3, где

20 компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из (b4) DMI-фунгицидов.

Вариант осуществления С5. Способ по варианту осуществления С4, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из ципроконазола, дифеноконазола, эпоксиконазола, миклобутанила,

25 протиоконазола и тетраконазола.

Вариант осуществления С6. Способ по варианту осуществления С5, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из ципроконазола, дифеноконазола и протиоконазола.

Вариант осуществления С7. Способ по варианту осуществления С2 или С3, где

30 компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из (b11) QoI-фунгицидов.

Вариант осуществления С8. Способ по варианту осуществления С7, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из азоксистробина, пикоксистробина и пираклостробина.

35 Вариант осуществления С9. Способ по варианту осуществления С2 или С3, где компонент (b) включает (b46.4) проквиназид.

Вариант осуществления С10. Способ по варианту осуществления С1, где болезнь представляет собой ржавчину и компонент (b) композиции включает фенпропиморф.

Вариант осуществления С11. Способ по варианту осуществления С10, где болезнь

40 представляет собой листовую ржавчину пшеницы.

Вариант осуществления С12. Способ по варианту осуществления С1, где болезнь представляет собой болезнь, вызываемую *Septoria*, и компонент (b) композиции включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из эпоксиконазола, металаксила (в том числе металаксила-М), ипроваликарба и

45 фенпропиморфа.

Вариант осуществления С13. Способ по варианту осуществления С12, где болезнь представляет собой пятнистость листьев пшеницы.

Вариант осуществления С14. Способ защиты растения от болезни, вызываемой

Septoria, включающий нанесение на растение фунгицидно эффективного количества композиции по варианту осуществления В49 или В50.

Вариант осуществления С15. Способ по варианту осуществления С14, где болезнь вызвана *Septoria tritici*.

5 Вариант осуществления С16. Способ по варианту осуществления С14 или С15, где болезнь представляет собой пятнистость листьев пшеницы.

Вариант осуществления С17. Способ по любому из вариантов осуществления С1-С16, где компоненты (а) и (b) наносятся в синергически эффективных количествах (и в синергическом соотношении относительно друг друга).

10 Следует отметить варианты осуществления, которые являются аналогами вариантов осуществления С1-С17, относящиеся к способу контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, включающему нанесение на растение или его часть фунгицидно эффективного количества фунгицидной композиции настоящего изобретения.

15 Как отмечается в кратком описании настоящего изобретения, настоящее изобретение также относится к соединению формулы 1 или к его N-оксиду, или соли. Также уже отмечено, что варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе варианты осуществления 1-51, также относятся к соединениям формулы 1. В соответствии с этим комбинации вариантов осуществления 1-51 дополнительно иллюстрируются при помощи  
20 следующего:

Вариант осуществления D1. Соединение формулы 1 или его N-оксид, или соль, где X представляет собой NH;

R<sup>1</sup> представляет собой галоген или метил;

25 R<sup>2</sup> представляет собой H;

R<sup>3</sup> представляет собой галоген или метил;

R<sup>4</sup> представляет собой галоген;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и

30 R<sub>6</sub> представляет собой H или галоген;

при условии, если R<sup>1</sup> представляет собой F, тогда R<sup>3</sup> представляет собой Cl, и если R<sup>1</sup> представляет собой Cl, тогда R<sup>3</sup> представляет собой F.

Вариант осуществления D2. Соединение по варианту осуществления D1, где

35 R<sup>3</sup> представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления D3. Соединение по варианту осуществления D2, где

R<sup>1</sup> представляет собой Cl или Br; и

R<sup>3</sup> представляет собой F.

40 Вариант осуществления D4. Соединение по любому из вариантов осуществления D1-D4, где чаще всего только один из R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> представляет собой H.

Вариант осуществления D5. Соединение по варианту осуществления D4, где

R<sup>4</sup> представляет собой F, Cl или Br;

45 R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, F, Cl или метокси; и

R<sup>6</sup> представляет собой H или F.

Вариант осуществления D6. Соединение по варианту осуществления D5, где

R<sup>5</sup> представляет собой циано, F, Cl или метокси.

Вариант осуществления D7. Соединение по любому из вариантов осуществления D1-D6, где соединение является иным, чем в виде N-оксида (т.е. в виде формулы 1 или его соли).

Вариант осуществления D8. Соединение по варианту осуществления D1, выбранное из группы, состоящей из:

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 239),

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 240) и

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 241).

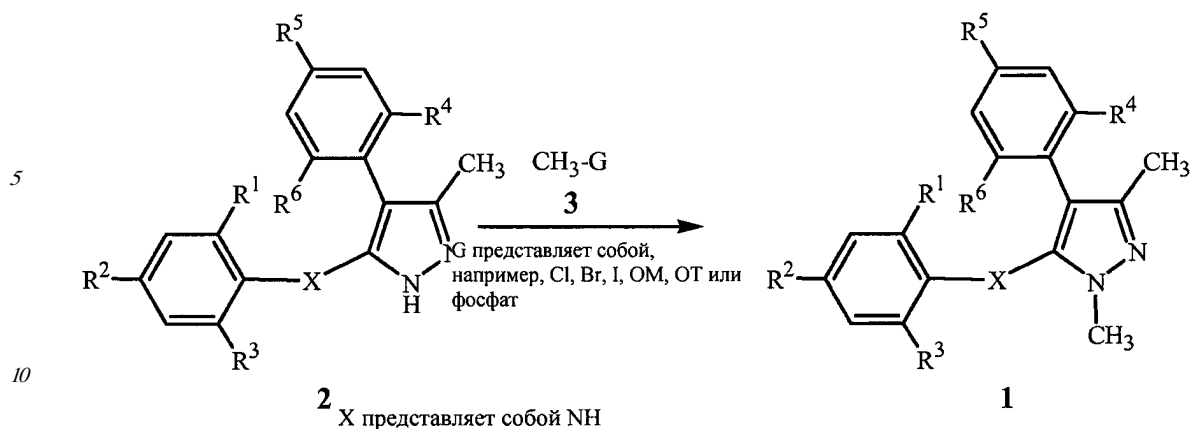
Дополнительные варианты осуществления включают фунгицидную композицию, содержащую: (1) соединение по любому из вариантов осуществления D1-D8 и (2) по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Дополнительные варианты осуществления также включают способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий нанесение фунгицидно эффективного количества соединения по любому из вариантов осуществления D1-D8 на растение (или его часть) или семя растения (непосредственно или через окружающую среду (например, среду для выращивания) растения или семени растения). Следует отметить варианты осуществления, относящиеся к способу контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, включающему нанесение на растение или его часть фунгицидно эффективного количества соединения по любому из вариантов осуществления D1-D8.

Один или несколько из следующих способов и вариаций, как описано на схемах 1-17, могут применяться для получения соединений формулы 1. Определения  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  и  $R^6$  в соединениях формулы 1-26 ниже представляют собой определяемые выше в кратком описании настоящего изобретения, если не указано иное. Формулы 1a и 1b представляют собой различные подклассы формулы 1; формулы 4a и 4b представляют собой различные подклассы формулы 4; формулы 6a и 6b представляют собой различные подклассы формулы 6; формула 11a является подклассом формулы 11; и формула 23a является подклассом формулы 23. Заместители для каждой формулы подкласса представляют собой определяемые для их основной формулы, если не указано иное.

Как показано на схеме 1, соединения формулы 1, в которых X представляет собой NH, можно получать с помощью реакции 1H-пиразольных соединений формулы 2 с различными метилирующими средствами (например, формула 3), такими как иодометан, метилсульфонаты (например, метилмесилат (OM) или тозилат (OT)) или триметилфосфат, предпочтительно в присутствии органического или неорганического основания, такого как 1,8-дизабицикло[5.4.0]ундец-7-ен, карбонат калия или гидроксид калия, и в растворителе, таком как N,N-диметилформамид (DMF), тетрагидрофуран (THF), толуол или вода.

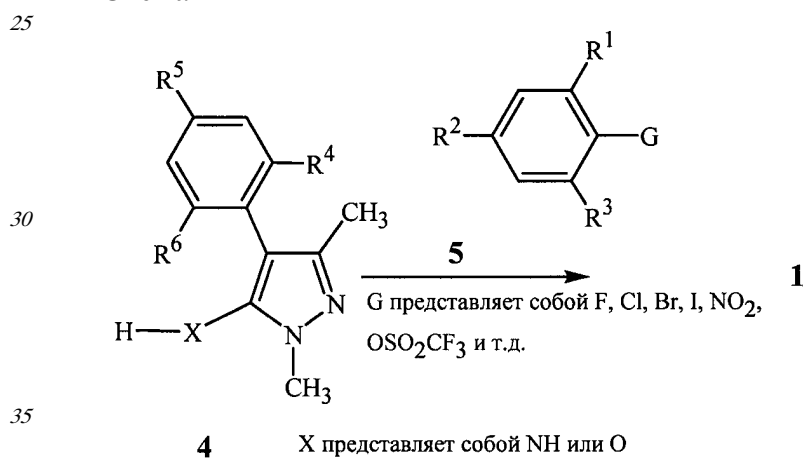
Схема 1



15 Как показано на схеме 2, соединения формулы 1 можно получать с помощью реакции соединений формулы 4 (т.е. 5-аминопиразолов с X, представляющим собой NH, или 5-гидроксипиразолов (5-пиразолонов) с X, представляющим собой O) с ароматическими соединениями формулы 5, содержащими уходящую группу G (т.е. галоген или (галоген) алкилсульфонат), необязательно в присутствии металлического катализатора и обычно в присутствии основания и полярного апротонного растворителя, такого как N,N-диметилформамид или диметилсульфоксид. Например, соединения формулы 5, где бензольное кольцо содержит электроноакцепторные заместители, реагируют

20 посредством прямого замещения уходящей группы G из кольца для обеспечения соединений формулы 1. Способ схемы 2 иллюстрируется стадией D примера синтеза 6. Соединения формулы 5 коммерчески доступны или их получение известно из уровня техники.

Схема 2

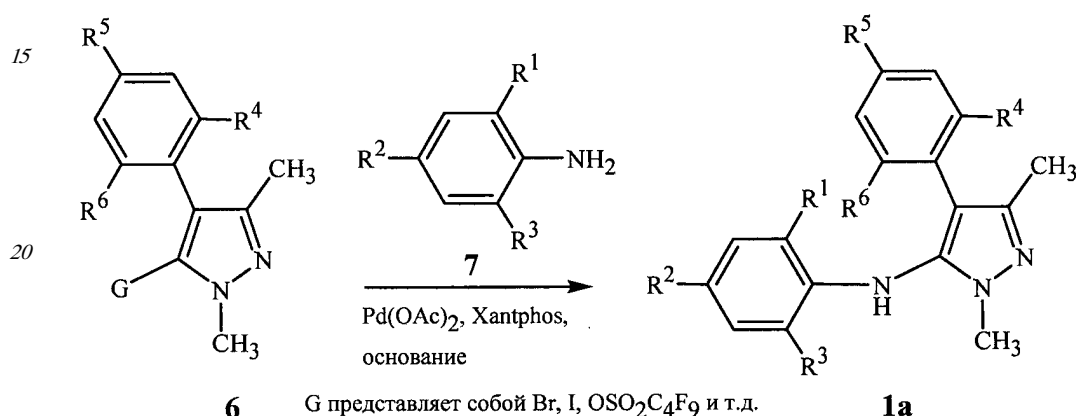


40 Для реакций по способу схемы 2 соединения формулы 4, где X представляет собой O или NH, с соединением формулы 5, где ароматическое кольцо не имеет достаточно электроноакцепторных заместителей, или для корректировки скорости реакции, выхода или чистоты продукта, применение металлического катализатора (например, металла или соли металла) в количествах, изменяющихся от каталитических до сверхстехиометрических, может способствовать желательной реакции. Типично для этих условий G представляет собой Br или I, или сульфонат, такой как  $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$  или  $\text{OS}(\text{O})_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ . Например, могут применяться комплексы солей меди (например, CuI с N,N'-диметилендиэтилендиамином, пролином или бипиридилом), комплексы палладия (например, трис(добензилиденацетон)дипалладий(0)) или соли палладия (например, ацетат палладия) с лигандами, такими как 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен (т.е. "Xantphos"), 2-дициклогексилфосфино-2',4',6'-триизопропилбифенил (т.е. "Xphos")

или 2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафталин (т.е. "BINAP"), в присутствии основания, такого как карбонат калия, карбонат цезия, феноксид натрия или трет-бутоксид натрия, в растворителе, таком как N,N-диметилформамид, 1,2-диметоксиэтан, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан или толуол, необязательно в смеси со спиртами, такими как этанол. В качестве альтернативы, как иллюстрируется на схеме 3, соединения формулы 1а (т.е. формулы 1, в которой X представляет собой NH) можно получать посредством реакции соединений формулы 6 (т.е. 5-бромпиразолов или иных пиразолов, замещенных в 5-положении уходящей группой) с соединениями формулы 7 при катализируемых металлом условиях, подобных тем, что описаны выше для схемы 2.

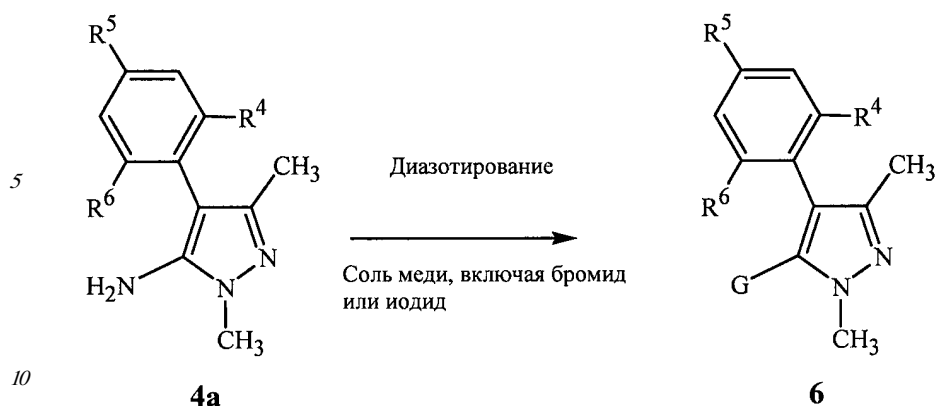
Способ схемы 3 иллюстрируется стадией С примера синтеза 1 и стадией Е примера синтеза 2. Соединения формулы 7 коммерчески доступны или их получение известно из уровня техники

Схема 3



Как показано на схеме 4, соединения формулы 6, где G представляет собой Br или I, можно получать посредством реакции 5-аминопиразолов формулы 4а (т.е. формулы 4, где X представляет собой NH) в условиях диазотирования либо в присутствии солей меди, либо с последующим комбинированием с солями меди, включающими бромид или иодид. Например, добавление трет-бутилнитрита к раствору 5-аминопиразола формулы 4а в присутствии CuBr<sub>2</sub> в растворителе, таком как ацетонитрил, обеспечивает соответствующий 5-бромпиразол формулы 6. Подобным образом 5-аминопиразол формулы 4а можно превращать в соль диазония, а затем в соответствующий 5-галогенпиразол формулы 6 посредством обработки нитритом натрия в растворителях, таких как вода, уксусная кислота или трифторуксусная кислота, в присутствии минеральной кислоты, содержащей, как правило, тот же атом галогенида (такой как водный раствор HI для G, представляющего собой I), с последующей обработкой соответствующей солью меди(I) или меди(II) согласно общим процедурам, хорошо известным специалистам в данной области. Способ схемы 4 иллюстрируется стадией В примера синтеза 1 и стадией D примера синтеза 2.

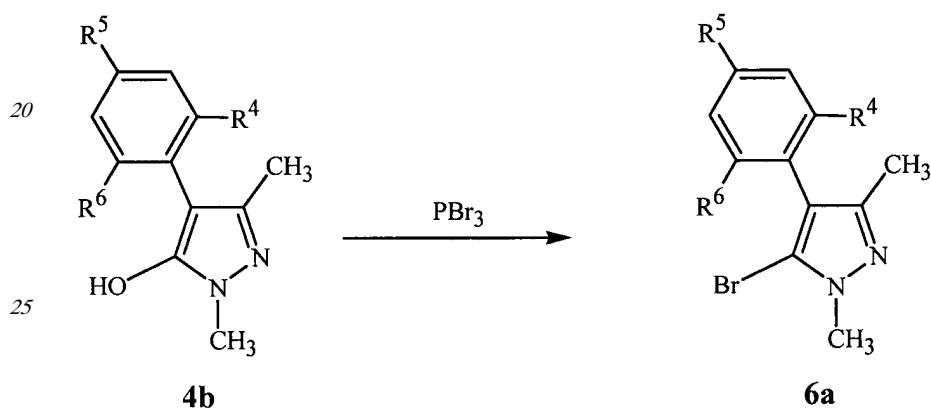
Схема 4



G представляет собой Br или I

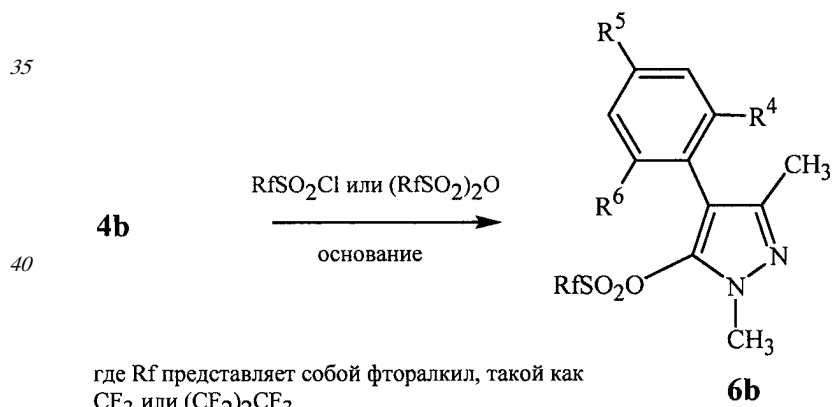
15 Как показано на схеме 5, 5-бромпиразолы формулы 6a (т.е. формулы 6, где G представляет собой Br) можно получать посредством реакции 5-гидроксипиразолов формулы 4b (т.е. формулы 4, где X представляет собой O) с трехбромистым фосфором, как описывается в Tetrahedron Lett. 2000, 41(24), 4713.

Схема 5



30 Как показано на схеме 6, 5-гидроксипиразолы формулы 4b могут также применяться для получения 5-фторалкилсульфонил (например, 5-трифторметансульфонил, 5-нонафторбутилсульфонил) пиразолов формулы 6b (т.е. формулы 6, где G представляет собой фторалкилсульфонил), как описывается в Synlett 2004, 5, 795.

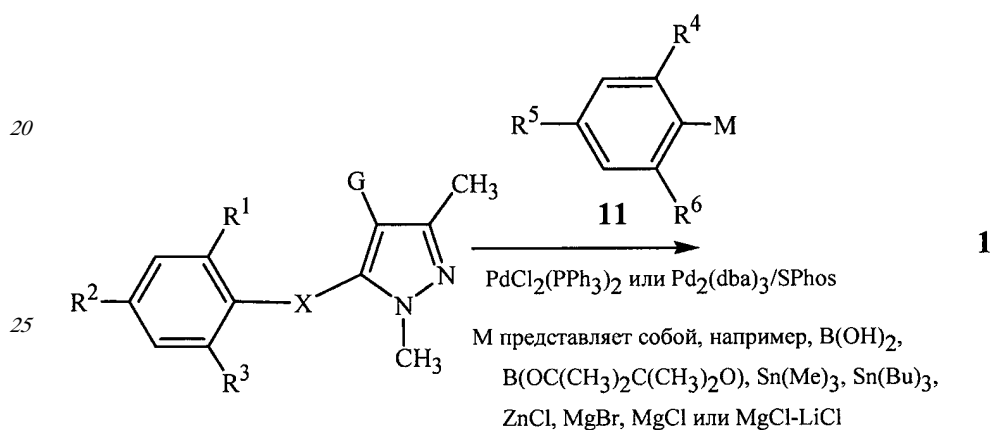
Схема 6



45 Как показано на схеме 7, соединения формулы 1 можно получать посредством реакции 4-бром- или иодпиразолов формулы 10, где X представляет собой O или NH, с органометаллическими соединениями формулы 11 в условиях катализируемой переходным металлом реакции кросс-сочетания. Реакция 4-бром- или иодпиразола

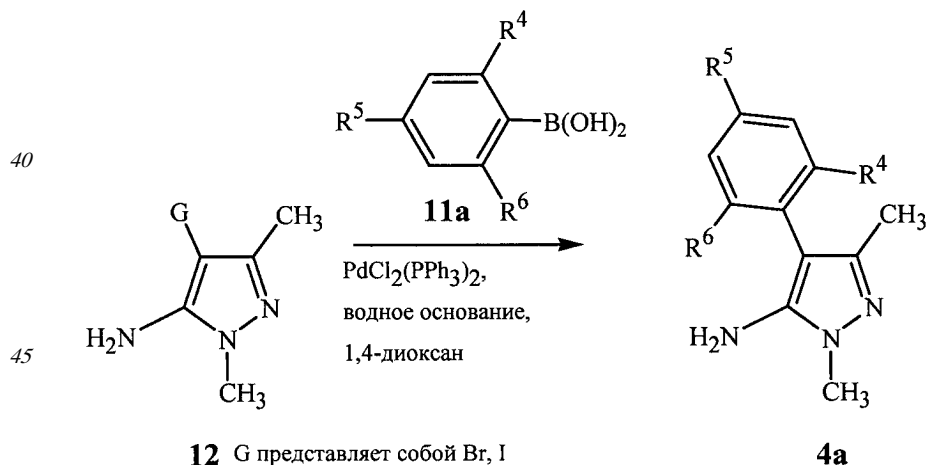
формулы 10 с бороновой кислотой, триалкилоловом, цинком или магниорганическим реагентом формулы 11 в присутствии палладиевого или никелевого катализатора, имеющего подходящие лиганды (например, трифенилфосфин (PPh<sub>3</sub>), дибензилиденацетон (dba), дициклогексил(2',6'-диметокси[1,1'-бифенил]-2-ил)фосфин (SPhos)) и основание, при необходимости, дает соответствующее соединение формулы 1. Например, замещенная арилбороновая кислота или производное, например, формула 11, где М представляет собой В(ОН)<sub>2</sub>, В(ОС(СН<sub>3</sub>)<sub>2</sub>С(СН<sub>3</sub>)<sub>2</sub>О) или В(О-*i*-Pr)<sub>3</sub> ⊖ Li ⊕, реагирует с 4-бром- или 4-иодпиразолом формулы 10 в присутствии дихлорбис(трифенилфосфин) палладия(II) и водного основания, такого как карбонат натрия или гидроксид калия, в растворителях, таких как 1,4-диоксан, 1,2-диметоксиэтан, толуол или этиловый спирт, или в безводных условиях с лигандом, таким как фосфиноксидный или фосфитный лиганд (например, дифенилфосфиноксид), и фторидом калия в растворителе, таком как 1,4-диоксан (смотри *Angewandte Chemie, International Edition* 2008, 47(25), 4695-4698), для обеспечения соответствующего соединения формулы 1. Способ схемы 7 иллюстрируется стадией С данного примера синтеза 3.

Схема 7



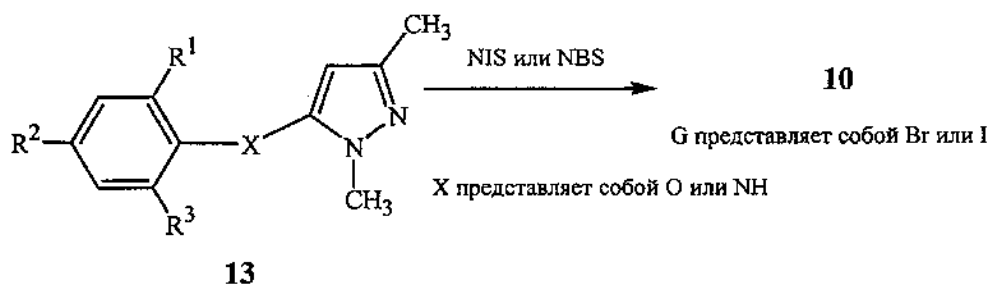
Как иллюстрируется на схеме 8, соединения формулы 4а (т.е. формулы 4, где Х представляет собой NH) можно получать посредством реакции соединений формулы 12 с соединениями формулы 11а (например, соединения формулы 11, где М представляет собой В(ОН)<sub>2</sub>) с применением условий катализируемой переходным металлом реакции кросс-сочетания, как описывается для способа схемы 7.

Схема 8



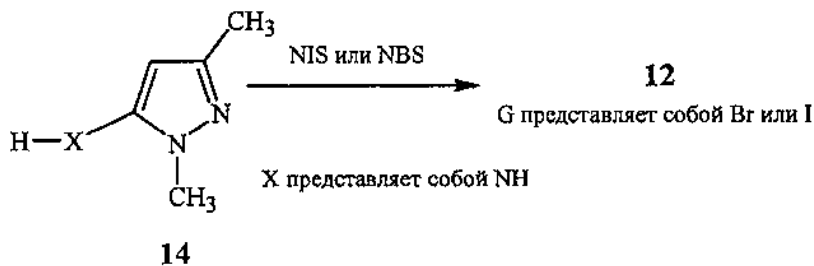
Как иллюстрируется на схеме 9, пиразолы формулы 10, где X представляет собой O или NH, и G представляет собой Br или I, легко получают посредством реакции пиразолов без замещения в 4-положении (формула 13) с галогенирующими реагентами, такими как бром, бромит натрия, N-бромсукцинимид (NBS) или N-иодосукцинимид (NIS), в растворителях, таких как уксусная кислота, ацетонитрил, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид или 1,4-диоксан, или смеси воды с вышеупомянутыми растворителями при температурах, изменяющихся от комнатной до точки кипения растворителя. Способ

Схема 9



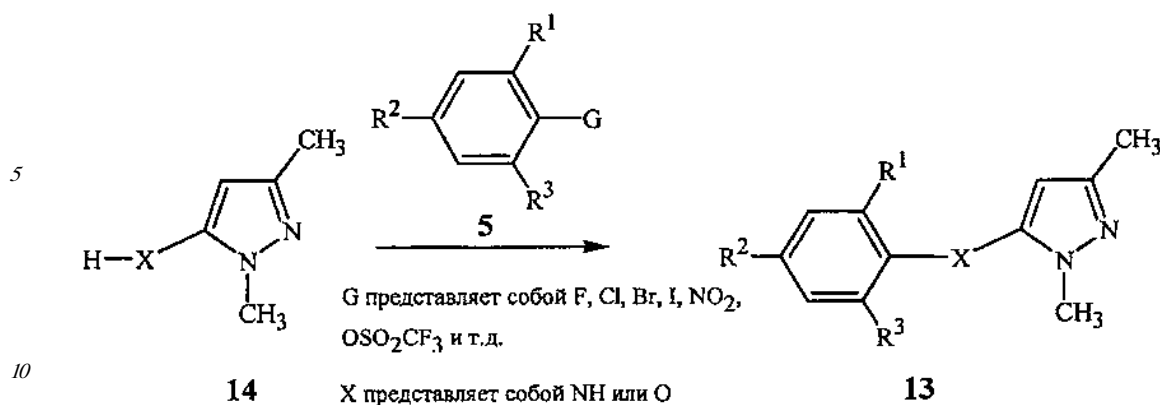
Как иллюстрируется на схеме 10, с применением условий реакции, подобных таковым для способа схемы 9, пиразол формулы 14, где X представляет собой NH, можно превращать в промежуточные продукты 12, которые применимы для получения соединений формулы 4а, как изображено на схеме 8. Соединение формулы 14, где X представляет собой NH, можно получать посредством способов, известных из уровня техники. Кроме того, коммерчески доступно соединение формулы 14, где X представляет собой NH.

Схема 10



Как показано на схеме 11, соединения формулы 13, где X представляет собой O или NH, можно получать из соответствующих соединений формулы 14 посредством процедур, аналогичных таковым, применяемым для способа схемы 2. Способ схемы 11 иллюстрируется стадией А примера синтеза 3. Соединения формулы 14 коммерчески доступны или их можно получать посредством способов, известных из уровня техники.

Схема 11



Как показано на схеме 12, соединения формулы 1b (т.е. формулы 1, где X представляет собой СНОН), можно получать посредством обработки соединений формулы 6

15 органическим реагентом (т.е. формулы 15), таким как алкиллитиевый, предпочтительно н-бутиллитиевый, или алкилмагнийевый реагент, предпочтительно изопропилмагний хлорид (необязательно в комплексе с хлоридом лития), с последующим добавлением замещенного бензальдегида формулы 16. Этот способ схемы 12 иллюстрируется примером синтеза 5. В качестве альтернативы соединения формулы 1b можно получать посредством восстановления кетонов формулы 19 с применением

20 стандартных способов, хорошо известных из уровня техники (например, борогидридом натрия в метаноле или метанолом). Кетоны формулы 19 можно получать посредством реакции того же металлизированного пиразольного производного соединения формулы 6 с углеродными электрофилами формулы 17 или 18. Температуры реакции могут изменяться от -90°C до точки кипения растворителя реакции; в основном

25 предпочтительны температуры от -78°C до комнатной температуры, когда применяется алкиллитиевый реагент, предпочтительны температуры от -78 до -10°C, и при применении алкилмагниевого реактива предпочтительны температуры от -20°C до комнатной. Применимо множество растворителей, таких как толуол, этиловый эфир, тетрагидрофуран или диметоксиметан; предпочтительным является безводный

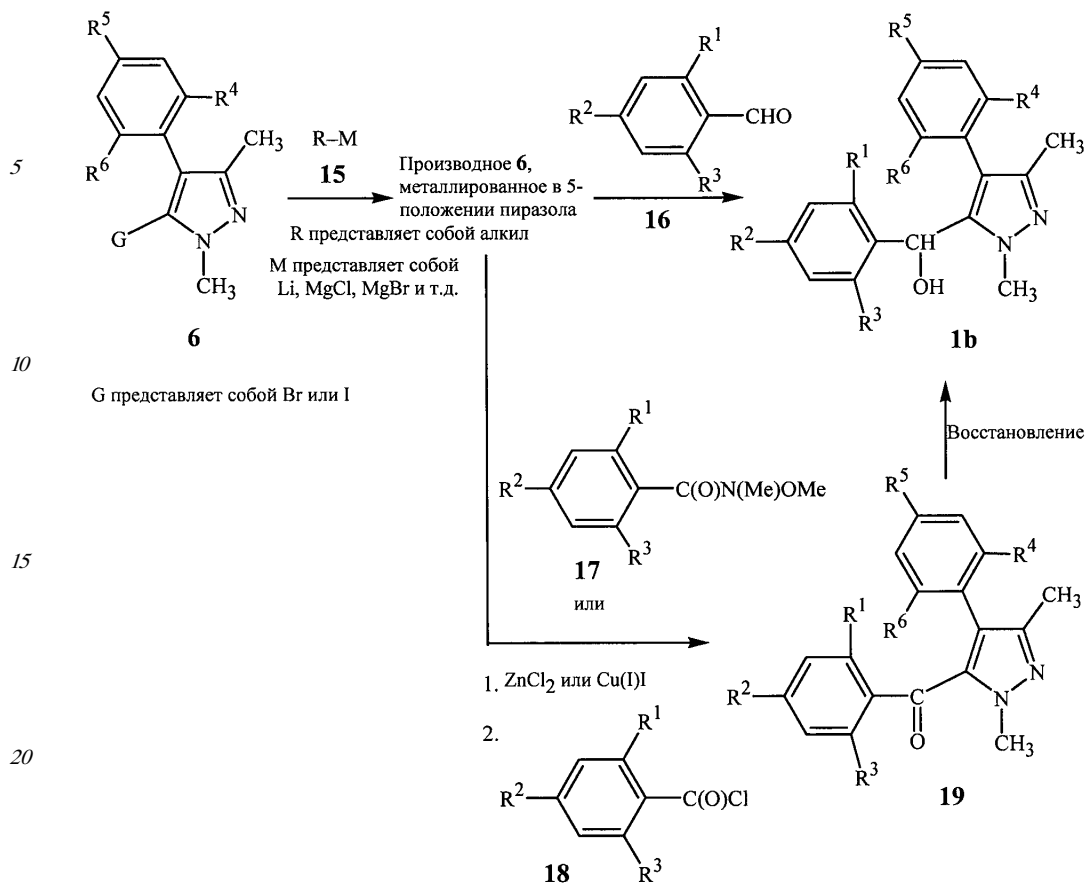
30 тетрагидрофуран. Второй металлический компонент, такой как хлорид цинка, бромид цинка или соль одновалентной меди, такая как иодид меди(I) или цианид меди(I), преимущественно может добавляться перед электрофилом в случаях, в которых электрофил является соединением формулы 18. Карбонильные промежуточные продукты формулы 16, 17 и 18 коммерчески доступны или их можно получать посредством

35 способов, известных из уровня техники.

Схема 12

40

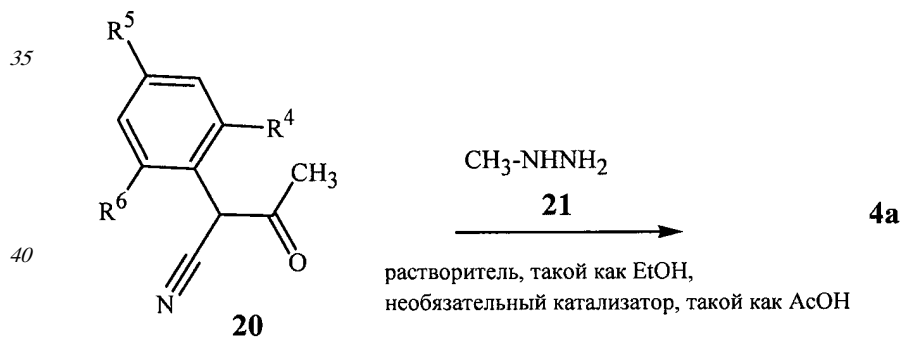
45



25 Специалисту в данной области будет понятно, что реакции, аналогичные показанным на схеме 12, можно также задействовать с пиразолами, не содержащими заместителя в 4 положении, что, таким образом, дает определенные соединения формулы 13, которые применимы в способе, кратко изложенном на схеме 9.

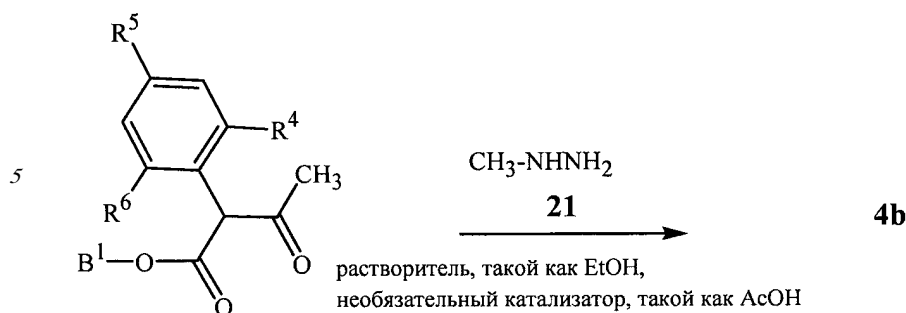
30 Общие способы, применимые для получения 5-аминопиразолов формулы 4a, хорошо известны из уровня техники; см., например, Journal für Praktische Chemie (Leipzig) 1911, 83, 171 и J. Am. Chem. Soc. 1954, 76, 501. Такой способ иллюстрируется на схеме 13. Способ схемы 13 иллюстрируется стадией А настоящего примера синтеза 1 и стадией С настоящего примера синтеза 2.

Схема 13



45 Подобным образом общие способы, применимые для получения 5-гидроксипиразолов формулы 4b, хорошо известны из уровня техники; см., например, Annalen der Chemie 1924, 436, 88. Такой способ иллюстрируется на схеме 14. Способ схемы 14 иллюстрируется стадией С настоящего примера синтеза 6.

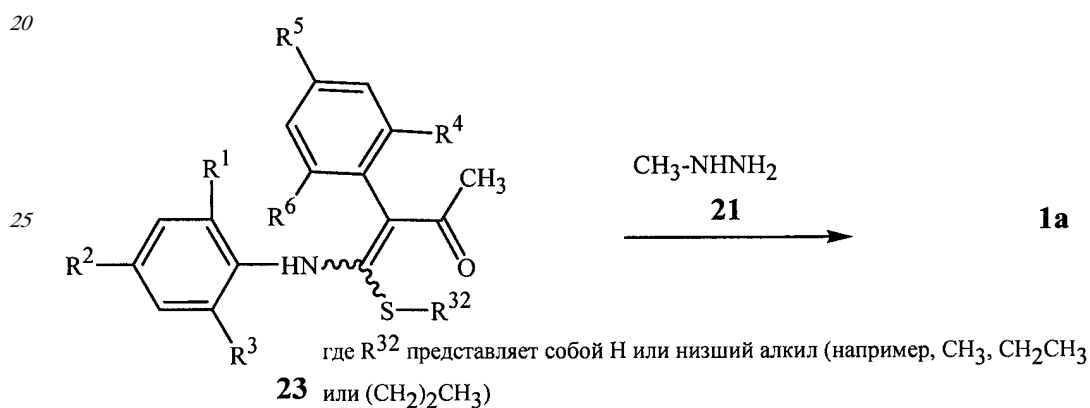
Схема 14



10 **22** В<sup>1</sup> представляет собой  
алкил, арил, бензил и т.д.

Как показано на схеме 15, соединения формулы 1a (т.е. формулы 1, где X представляет собой NH) можно получать посредством конденсации соединений формулы 23 с метилгидразином (формула 21) в растворителе, таком как этанол или метанол, и  
15 необязательно в присутствии кислотного или основного катализатора, такого как уксусная кислота, пиперидин или метоксид натрия, согласно общим процедурам, известным из уровня техники. Способ схемы 15 иллюстрируется стадией В примера синтеза 4 и стадией С примера синтеза 7.

Схема 15

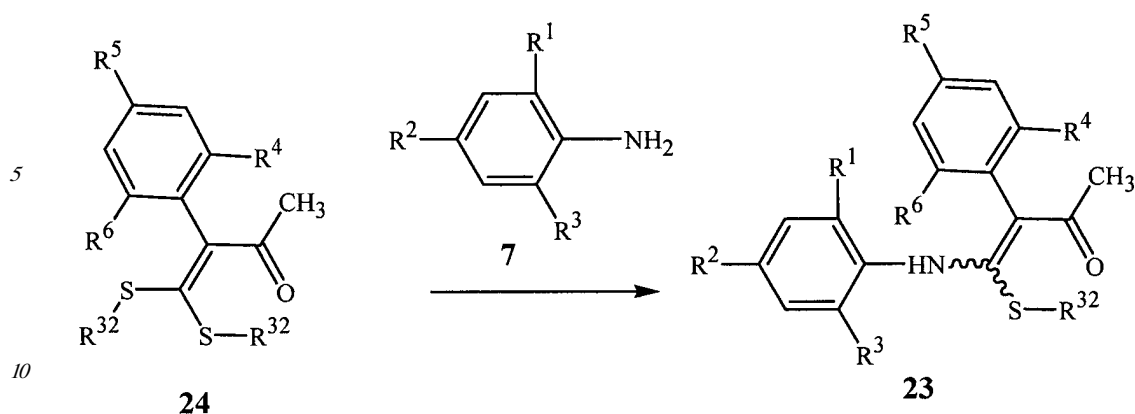


30 Способом, аналогичным способу схемы 15, соединения формулы 2, где X представляет собой NH, могут получать подобным образом посредством конденсации соединений формулы 23 с гидразином. Этот способ описывается в Chemistry of Heterocyclic Compounds 2005, 41(1), 105-110.

35 Как показано на схеме 16, соединения формулы 23 (где R<sup>32</sup> представляет собой Н или низший алкил, такой как CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> или (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>) можно получать посредством реакции соответствующих соединений дитиоацетала кетена формулы 24 с соединениями формулы 7 необязательно в присутствии основания, такого как гидрид натрия или хлорид этилмагния, в растворителях, таких как толуол, тетрагидрофуран или  
40 диметоксиметан, при температурах, изменяющихся от -10°C до точки кипения растворителя. См., например, J. Heterocycl. Chem. 1975, 12(1), 139. Способы, применимые для получения соединений формулы 24, известны из уровня техники.

Схема 16

45



где  $R^{32}$  представляет собой H или низший алкил (например,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$  или  $(CH_2)_2CH_3$ )

Как показано на схеме 17, соединения формулы 23а (т.е. таутомер формулы 23, где  $R^{32}$  представляет собой H) можно получать посредством реакции соответствующих

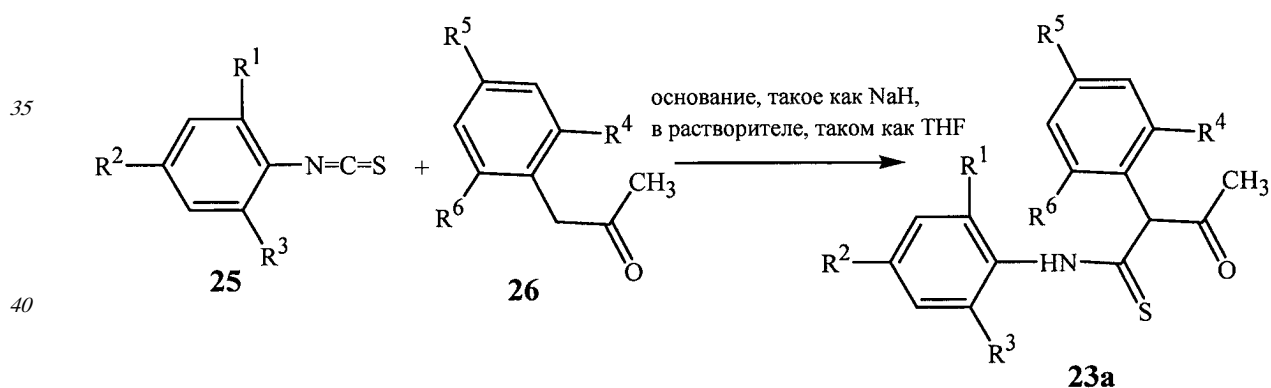
15 изотиоцианатных соединений формулы 25 с арилацетоновыми соединениями формулы 26; см., например, Zhurnal Organicheskoi Khimii 1982, 18(12), 2501. Основания, применимые для этой реакции, включают гидрид натрия, алкоксидные основания (например, трет-бутоксид калия или этоксид натрия), гидроксид калия, гидроксид натрия, карбонат калия или аминовые основания (например, триэтиламин или N,N-диизопропилэтиламин).

20 Применимыми являются множество растворителей, такие как тетрагидрофуран, эфир, толуол, N,N-диметилформамид, спирты (например, этанол), сложные эфиры (например, этилацетат или изопропилацетат) или их смеси. Как хорошо известно из уровня техники, растворители выбирают относительно их совместимости с выбранным основанием.

25 Температуры реакции могут изменяться от  $-78^\circ C$  до точки кипения растворителя. Одной применимой смесью основания и растворителя является трет-бутоксид калия в тетрагидрофуране, к которой при от  $-70$  до  $0^\circ C$  добавляется раствор изотиоцианата формулы 25 и карбонильного соединения формулы 26, которые либо комбинируются в один раствор, либо добавляются отдельно, предпочтительно посредством добавления карбонильного соединения с последующим добавлением изотиоцианата. Способ схемы

30 17 иллюстрируется стадией А примера синтеза 4 и стадией С примера синтеза 7.

Схема 17



45 Кетотиоамиды формулы 23а также можно получать, предоставляя возможность соответствующим кетоамидам вступать в реакцию с сульфорирующим средством, таким как реактив Лоуссона или  $P_2S_5$ ; см., например, Helv. Chim. Act. 1998, 81(7), 1207.

Специалисту в данной области будет понятно, что различные функциональные группы можно превращать в другие для обеспечения отличающихся соединений формулы 1. Например, промежуточные продукты для получения соединений формулы

1 могут содержать ароматические нитрогруппы, которые можно восстанавливать до  
аминогрупп и затем превращать через реакции, хорошо известные из уровня техники,  
такие как реакция Зандмейера, в различные галогениды, обеспечивая соединения  
формулы 1. Посредством подобных известных реакций ароматические амины (анилины)  
5 можно превращать через соли диазония в фенолы, которые можно затем алкилировать  
для получения соединений формулы 1 с алкокси-заместителями. Подобным образом  
ароматические галогениды, такие как бромиды или иодиды, полученные через реакцию  
Зандмейера, могут вступать в реакцию со спиртами при катализируемых медью условиях,  
такую как реакция Ульмана или ее известные модификации, для обеспечения соединений  
10 формулы 1, которые содержат алкокси-заместители. Кроме того, некоторые галогеновые  
группы, такие как фтор или хлор, могут быть замещены спиртами при основных  
условиях для обеспечения соединений формулы 1, содержащих соответствующие  
алкокси-заместители.

Вышеприведенные реакции также можно во многих случаях осуществлять в  
15 альтернативной последовательности, такой как получение 1Н-пиразолов для применения  
в реакции на схеме 2 посредством реакций, которые иллюстрируются далее для общего  
получения замещенных пиразолов.

Понятно, что некоторые реагенты и условия реакции, описанные выше для получения  
соединений формулы 1, могут быть не совместимыми с определенными  
20 функциональностями, присутствующими в промежуточных продуктах. В этих случаях  
включение последовательностей введения защиты/снятия защиты или взаимные  
превращения функциональных групп в синтезе будут способствовать получению  
желательных продуктов. Применение и выбор защитных групп будут очевидны для  
специалиста в химическом синтезе (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective*  
25 *Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалист в данной области  
поймет, что в некоторых случаях после введения данного реагента, как это изображено  
на любой отдельной схеме, для завершения синтеза соединений формулы 1 может быть  
необходимым осуществлять дополнительные общепринятые стадии синтеза, не  
описанные детально. Специалист в данной области также поймет, что может быть  
30 необходимым осуществить комбинацию стадий, проиллюстрированных на  
вышеприведенных схемах, в ином порядке, чем подразумевается конкретной  
последовательностью, представленной для получения соединений формулы 1.  
Специалист в данной области также поймет, что соединения формулы 1 и  
промежуточные продукты, описанные в данном документе, могут подвергаться  
35 различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, органометаллическим,  
окислительным и восстановительным реакциям, чтобы добавить заместители или  
модифицировать существующие заместители.

Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области с  
применением предшествующего описания может использовать настоящее изобретение  
40 в его наиболее полном объеме. Поэтому, следующие примеры синтеза расцениваются  
всего лишь как иллюстративные и не ограничивающие никоим образом раскрытие.  
Стадии в следующих примерах синтеза иллюстрируют процедуру для каждой стадии  
в суммарном синтетическом преобразовании, и исходный материал для каждой стадии  
не обязательно должен быть получен посредством конкретного подготовительного  
45 действия, процедура которого описывается в других примерах или стадиях. Процентные  
соотношения приводятся по весу, за исключением смесей хроматографических  
растворителей или где указывается иное. Части и процентные соотношения для смесей  
хроматографических растворителей приводятся по объему, если не указывается иное.

Спектры  $^1\text{H}$  ЯМР сообщаются в м.д. (ppm) слабого поля от тетраметилсилана в  $\text{CDCl}_3$ , если не указывается иное; “с” означает синглет, “м” означает мультиплет, “шир. с” означает широкий синглет. Массовые спектры (MS) сообщаются в виде молекулярного веса исходного иона с самым высоким относительным содержанием изотопа (M+1), образованного добавлением  $\text{H}^+$  (молекулярный вес 1) к молекуле, что наблюдали посредством масс-спектрометрии с применением химической ионизации при атмосферном давлении ( $\text{AP}^+$ ), где “amu” означает атомные единицы массы. О присутствии молекулярных ионов, включая один или несколько изотопов с более высоким атомным весом меньшего относительного содержания (например,  $^{37}\text{Cl}$ ,  $^{81}\text{Br}$ ), не сообщается. “LC/MS” относится к комбинации физического разделения химических соединений с помощью жидкостной хроматографии и анализа масс разделенных соединений посредством масс-спектрометрии.

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 3)

Стадия А: Получение 4-[2-хлор-4-фторфенил]-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

Суспензию сухого твердого этоксида натрия (Aldrich, 10,2 г, 150 ммоль) в смеси ксиленов (60 мл) и безводного этанола (25 мл) перемешивали при  $70^\circ\text{C}$ , и раствор 2-хлор-4-фторбензолацетонитрила (16,96 г, 100 ммоль) в смеси этилацетата (30 мл) и этанола (5 мл) добавляли по каплям к горячей реакционной смеси в течение 20 минут. Реакционную смесь нагревали при  $75\text{--}78^\circ\text{C}$  в течение 3 часов и затем дали возможность остыть. Добавили воду (50 мл) для растворения твердых веществ. Смесь однократно экстрагировали этилацетатом, и экстракт отбросили. Водную фазу подкислили до pH 2 добавлением 1 н. водной соляной кислоты и затем экстрагировали этилацетатом (50 мл). Этилацетатную фазу высушили ( $\text{MgSO}_4$ ) и выпарили для обеспечения промежуточного продукта  $\alpha$ -ацетил-2-хлор-4-фторбензолацетонитрила в виде твердого вещества (14,8 г).

Порцию продукта, полученного выше (4,61 г, 21,8 ммоль), перемешивали в этаноле (15 мл), и добавили ледяную уксусную кислоту (3 мл) и метилгидразин (1,17 мл, 21,8 ммоль). Эту реакционную смесь перемешивали и нагревали в течение ночи с обратным холодильником. Реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении, и получившийся в результате остаток растерли в порошок с этилацетатом. Получившиеся в результате твердые вещества собрали на стеклоцементе и высушили на воздухе для обеспечения названного соединения в виде твердого вещества белого цвета (2,42 г).

$^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  7,2-7,3 (м, 2H), 7,0 (м, 1H), 3,7 (с, 3H), 3,4 (шир. с, 2H), 2,1 (с, 3H).

МС: 240 amu ( $\text{AP}^+$ ).

Стадия В: Получение 5-бром-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразола

Бромид меди(II) (3,94 г, 17,7 ммоль) добавили к раствору 4-[2-хлор-4-фторфенил]-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (т.е. продукта стадии А) (2,4 г, 10 ммоль) в ацетонитриле (50 мл) и смесь перемешивали и охлаждали в бане с ледяной водой, и в тоже время по каплям добавляли трет-бутилнитрит (90% техническая чистота, 2,33 мл, 17,7 ммоль) в течение 5 мин. Реакционной смеси дали возможность медленно нагреться до комнатной температуры. Добавили водный раствор  $\text{HCl}$  (20 мл), и затем добавили этилацетат (20 мл). Эту смесь профильтровали через 2-см подушку из диатомитового вспомогательного фильтрующего материала Celite®. Фильтровальную подушку промыли этилацетатом (20 мл), и разделили фазы. Органическую фазу промыли 1,0 н. водным раствором

соляной кислоты и рассолом, высушили над  $MgSO_4$  и концентрировали с выходом названного соединения в виде полутвердого вещества оранжево-коричневого цвета (2,8 г).

$^1H$  ЯМР  $\delta$  7,18-7,25 (м, 2H), 7,04 (м, 1H), 3,89 (с, 3H), 2,14 (с, 3H).

Стадия С: Получение 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

Соединили 5-бром-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол (т.е. продукт стадии В) (0,20 г, 0,66 ммоль), ацетат палладия(II) (15 мг, 0,066 ммоль), 4,5-бис (дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен (76 мг, 0,13 ммоль) и измельченный в порошок карбонат калия (1,8 г, 13 ммоль) в безводном 1,4-диоксане (3 мл) и смесь барботировали подповерхностным потоком газа  $N_2$  в течение 10 мин. Одной порцией добавили 2,6-

дифтор-4-метоксианилин (0,22 г, 1,3 ммоль), и реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 22 часов. Реакционную смесь профильтровали через

диатомитовый вспомогательный фильтрующий материал Celite<sup>®</sup>, и фильтровальную подушку промыли этилацетатом (20 мл). Фильтрат промыли водой (10 мл) и рассолом (10 мл), высушили над  $MgSO_4$  и концентрировали с выходом полутвердого остатка. Этот остаток очищали посредством колоночной хроматографии через 5 г силикагеля, элюировали градиентом гексанов/этилацетата (от 20:1 до 1:3) с получением названного

соединения в виде твердого вещества светло-коричневого цвета (48 мг).  $^1H$  ЯМР  $\delta$  7,0-7,1 (м, 2H), 6,85 (м, 1H), 6,26 (м, 2H), 4,84 (шир. с, 1H), 3,78 (с, 3H), 3,66 (с, 3H), 2,08 (с, 3H). МС: 382 amu ( $AP^+$ ).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение 4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-амина (соединение 7)

Стадия А: Получение 2,6-дифтор-4-метоксибензолацетонитрила

Раствор KCN (0,88 г, 13 ммоль), растворенный в воде (2 мл), добавили по каплям к охлажденному в водяной бане раствору 2,6-дифтор-4-метоксибензилбромида (2,50 г, 10,5 ммоль) в N,N-диметилформамиде (10 мл). Реакционную смесь перемешивали в течение 20 мин. Добавили воду (20 мл), и затем реакционную смесь влили в насыщенный водный раствор  $NaHCO_3$  (20 мл) и экстрагировали эфиром (50 мл). Органическую фазу промыли водой (5×25 мл), высушили над  $MgSO_4$  и концентрировали с получением масла, которое кристаллизовали в спокойном состоянии для обеспечения названного

соединения в виде твердого вещества белого цвета (1,9 г).  $^1H$  ЯМР  $\delta$  6,50 (м, 2H), 3,80 (с, 3H), 3,65 (с, 2H).

Стадия В: Получение  $\alpha$ -ацетил-2,6-дифтор-4-метоксибензолацетонитрила

Твердый этоксид натрия (4,7 г, 66 ммоль) перемешивали в смеси ксилена (20 мл) и этанола (10 мл) и нагрели до 50°C. По каплям добавили раствор 2,6-дифтор-4-метоксибензолацетонитрила (т.е. продукта стадии А) (8,0 г, 44 ммоль) в этилацетате (10,4 мл). Реакционную смесь нагревали при 50°C в течение 4 часов и затем дали возможность остыть до комнатной температуры. Реакционную смесь влили в воду (100 мл) и экстрагировали этилацетатом (25 мл). Водную фазу подкислили 3 н. водной HCl до pH 4 и экстрагировали этилацетатом (100 мл). Эту органическую фазу промыли водой (50 мл), рассолом (50 мл), затем высушили над  $MgSO_4$  и концентрировали с выходом названного соединения в виде полутвердого вещества рыжевато-коричневого цвета (8,0 г).

$^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  6,56 (м, 2H), 4,86 (с, 1H), 3,83 (с, 3H), 2,40 (с, 3H).

Стадия С: Получение 4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

5 Перемешивали  $\alpha$ -ацетил-2,6-дифтор-4-метоксибензолацетонитрил (т.е. продукт стадии В) (8,03 г, 35,7 ммоль) и уксусную кислоту (5 мл) в этаноле (35 мл) и добавили метилгидразин (1,91 мл, 35,7 ммоль). Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 16 часов, охладили и затем влили в воду (100 мл). Получающуюся в результате смесь экстрагировали этилацетатом (100 мл). Органическую фазу промыли 1 н. водным NaOH (50 мл) и затем рассолом (50 мл), высушили над  $\text{MgSO}_4$  10 и концентрировали с выходом твердого вещества. Твердое вещество растворили в метаноле и получающийся в результате раствор нагрели до  $45^\circ\text{C}$ . Добавили по каплям воду (25 мл) и смеси дали возможность охладиться. Осадок собирали на стеклоцементе с получением названного соединения в виде твердого вещества белого цвета (3,88 г).

15  $^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  6,55 (м, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,67 (с, 3H), 3,43 (шир. с, 2H), 2,09 (с, 3H).

Стадия D: Получение 5-бром-4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразола  
Бромид меди(II) (3,81 г, 16,9 ммоль) добавили к раствору 4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (т.е. продукта стадии С) (3,88 г, 15,4 ммоль) в ацетонитриле (50 мл), и смесь перемешивали и охлаждали в бане с ледяной 20 водой, при этом по каплям добавляли трет-бутилнитрит (90% техническая чистота, 3,54 мл, 26,9 ммоль) в течение 5 мин. Реакционной смеси дали возможность медленно нагреться до комнатной температуры. Добавили водный раствор соляной кислоты (25 мл), затем добавили этилацетат (25 мл), и получающуюся в результате смесь профильтровали через 2-см подушку из диатомитового вспомогательного фильтрующего 25 материала Celite<sup>®</sup>. Фильтровальную подушку промыли этилацетатом (50 мл), и фазы разделили. Органическую фазу промыли 1 н. водным раствором HCl (25 мл) и рассолом (25 мл), высушили над  $\text{MgSO}_4$  и концентрировали. Остаток очищали посредством колоночной хроматографии через 24 г силикагеля, элюировали градиентом гексанов/этилацетата (от 9:1 до 1:1) с получением названного соединения в виде твердого вещества 30 белого цвета (3,25 г).

$^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  6,54 (м, 2H), 3,88 (с, 3H), 3,83 (с, 3H), 2,16 (с, 3H).

Стадия E: Получение 4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-N-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-амина

35 Соединили 5-бром-4-(2,6-дифтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол (т.е. продукт стадии D) (0,30 г, 0,94 ммоль), ацетат палладия(II) (20 мг, 0,090 ммоль), 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен (0,11 г, 0,19 ммоль) и измельченный в порошок карбонат калия (2,6 г, 19 ммоль) в безводном 1,4-диоксане (4 мл), и получающуюся в результате смесь барботировали подповерхностным потоком газа  $\text{N}_2$  в течение 10 мин. 40 Одной порцией добавили 2,4,6-трифторанилин (0,28 г, 1,9 ммоль), и реакционную смесь нагревали с обратным холодильником под азотом в течение 22 часов. Реакционную смесь охладили, затем профильтровали через диатомитовый вспомогательный фильтрующий материал Celite<sup>®</sup>. Фильтровальную подушку промыли этилацетатом (20 мл), и фильтрат промыли водой (10 мл) и рассолом (10 мл), высушили над  $\text{MgSO}_4$  и 45 концентрировали с выходом полутвердого остатка. Остаток очищали посредством колоночной хроматографии через 12 г силикагеля, элюировали градиентом гексанов/этилацетата (от 20:1 до 1:3) с получением названного соединения в виде полутвердого вещества (73 мг).

<sup>1</sup>H ЯМР (ацетон-d6) δ 6,84 (шир. с, 1H), 6,68 (м, 2H), 6,43 (м, 2H), 3,77 (с, 3H), 3,75 (с, 3H), 1,99 (с, 3H). МС: 384 amu (AP<sup>+</sup>).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 3

Получение 4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила (соединение 13)

Стадия А: Получение 4-[(1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил)окси]-3,5-дифторбензонитрила

Карбонат калия (1,38 г, 10 ммоль) добавили к раствору 2,4-дигидро-2,5-диметил-3H-пиразол-3-она (0,70 г, 6,3 ммоль) в N,N-диметилформамиде (15 мл). Добавили 3,4,5-трифторбензонитрил (0,94 г, 6,0 ммоль), и реакционную смесь нагревали при 75°C под атмосферой азота в течение 16 часов, затем дали возможность остыть. Реакционную смесь распределили между водой (60 мл) и этилацетатом (30 мл). Органическую фазу промыли водой (2×30 мл) и рассолом (30 мл), высушили над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали с получением названного соединения в виде масла желтого цвета (1,38 г).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,36 (м, 2H), 5,24 (с, 1H), 3,78 (с, 3H), 2,16 (с, 3H).

Стадия В: Получение 3,5-дифтор-4-[(4-иодо-1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил)окси]бензонитрила

Раствор 4-[(1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил)окси]-3,5-дифторбензонитрила (т.е. продукта стадии А) (1,38 г, 5,5 ммоль) в ацетонитриле (20 мл) перемешивали при комнатной температуре, и одной порцией добавили N-иодосукцинимид (1,35 г, 6,0 ммоль).

Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 2 часов, охладили и затем влили в воду (40 мл). Получающуюся в результате смесь экстрагировали этилацетатом (40 мл). Органическую фазу промыли водой (20 мл) и насыщенным водным раствором NaHCO<sub>3</sub> (20 мл), высушили над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали при пониженном давлении с получением названного соединения в виде твердого вещества рыжевато-коричневого цвета (2,1 г).

<sup>1</sup>H ЯМР (ацетон-d6) δ 7,80 (м, 2H), 3,82 (с, 3H), 2,09 (с, 3H). МС: 376 amu (AP<sup>+</sup>).

Стадия С: Получение 4-[[4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила

К раствору 3,5-дифтор-4-[(4-иодо-1,3-диметил-1H-пиразол-5-ил)окси]бензонитрила (т.е. продукта стадии В) (1,0 г, 2,67 ммоль) в 1,4-диоксане (6 мл) добавили 2-хлор-4-фторбензолбороновую кислоту (альтернативно называемую В-(2-хлор-4-фторфенил)бороновой кислотой) (0,93 г, 5,33 ммоль), дихлор (бис)трифенилфосфин палладий(II) (альтернативно называемый бис(трифенилфосфин)палладий(II) дихлорид) (93 мг, 0,13 ммоль), карбонат калия (0,74 г, 5,33 ммоль) и воду (4 мл). Получающуюся в результате смесь нагревали с обратным холодильником в течение 5 часов, дали возможность остыть и распределили между водой (20 мл) и этилацетатом (20 мл). Органический слой высушили над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали. Остаток очищали посредством хроматографии на силикагеле с градиентом гексанов/этилацетата для получения названного соединения в виде твердого вещества серовато-белого цвета (110 мг).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,00-7,09 (м, 3H), 6,97 (м, 1H), 6,86 (м, 1H), 3,85 (с, 3H), 2,02 (с, 3H).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 4

Получение 4-(2,4-дихлорфенил)-N-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин (соединение 17)

Стадия А: Получение α-ацетил-2,4-дихлор-N-(2,4-дифторфенил)бензолэтантдиоамида

Добавили 2,4-дифторфенил изотиоцианат (0,27 мл, 2,0 ммоль) к перемешанной суспензии гидроксида натрия (60% в минеральном масле) (112 мг, 2,8 ммоль) в безводном

тетрагидрофуране (4 мл), охлажденном в бане с ледяной водой, под атмосферой азота. По каплям добавляли раствор 1-(2,4-дихлорфенил)-2-пропанона (570 мг, 2,8 ммоль) в тетрагидрофуране (4 мл) в течение 5 мин. Получившийся в результате желтый раствор перемешивали при 5-10°C в течение 1 часа. Осторожно добавили воду (10 мл), и  
 5 реакцию смесь экстрагировали этилацетатом (10 мл). Водную фазу подкислили до рН 3 с помощью 1 н. водной HCl, затем экстрагировали этилацетатом (20 мл). Органический экстракт промыли водой (10 мл) и рассолом (10 мл), высушили над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали с выходом твердого вещества. Твердое вещество растерли в порошок с гексанами/этилацетатом (2:1), собрали на стеклоцементе и высушили на воздухе с  
 10 получением названного соединения в виде твердого вещества белого цвета (240 мг). МС: 373 amu (AP<sup>+</sup>).

Стадия В: Получение 4-(2,4-дихлорфенил)-N-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

Уксусную кислоту (50 мкл) и метилгидразин (41 мкл) добавили к перемешанной  
 15 суспензии α-ацетил-2,4-дихлор-N-(2,4-дифторфенил)бензолэтантаноамида (238 мг, 0,64 ммоль) в этаноле (4 мл). Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 2 часов и дали ей возможность остыть. Затем реакцию смесь развели этилацетатом (10 мл) и промыли 1 н. водным NaOH (10 мл), водой (10 мл) и рассолом  
 20 (10 мл), высушили над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали с выходом твердого остатка. Остаток очищали посредством колоночной хроматографии на 5 г силикагеля с градиентом гексанов/этилацетата (от 2:1 до 1:1) с получением названного соединения в виде твердого вещества (170 мг).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,43 (с, 1H), 7,19 (м, 1H), 7,07 (м, 1H), 6,78 (м, 1H), 6,62 (м, 1H), 6,37 (м, 1H),  
 25 5,22 (шир. с, 1H), 3,70 (с, 3H), 2,18 (с, 3H). МС: 368 amu (AP<sup>+</sup>).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 5

Получение 4-(2-хлор-4-фторфенил)-α-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-метанола (соединение 122)

Растворили 5-бром-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол (т.е. продукт  
 30 примера синтеза 1, стадии В) (0,25 г, 0,82 ммоль) в безводном тетрагидрофуране (12 мл), и смесь охладили в бане с сухим льдом/ацетоном под атмосферой азота. По каплям добавляли гексановый раствор н-бутиллития (2,0 М, 0,49 мл, 0,98 ммоль) в течение 5 минут. После 15 минут медленно по каплям добавили раствор 2,4-дифторбензальдегида  
 35 (0,09 мл, 0,82 ммоль) в безводном тетрагидрофуране (3 мл), что вызвало осветление окрашенного в темно-красный цвет раствора до желтого цвета. После 45 минут реакцию смесь гасили добавлением насыщенного водного раствора NH<sub>4</sub>Cl (~20 мл) и дали возможность нагреться до комнатной температуры. Эту смесь экстрагировали этилацетатом, и органическую фазу промыли насыщенным водным раствором NH<sub>4</sub>Cl  
 40 (25 мл) и рассолом, высушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и концентрировали с выходом вязкого остатка. Этот остаток очищали посредством колоночной хроматографии через силикагель, элюировали градиентом этилацетата в гексане (от 7% до 10%) с получением названного соединения в виде полутвердого вещества белого цвета (109 мг).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,5 (м, 1H), 7,1 (м, 2H), 7,0 (м, 1H), 6,85 (м, 2H), 6,0 (шир. с, 1H), 5,9 (с, 1H),  
 45 3,8 (с, 3H), 2,1 (с, 3H), МС: 367 amu (AP<sup>+</sup>).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 6

Получение 4-[[1,3-диметил-4-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-ил]окси]-3,5-

дифторбензонитрила (соединение 8)

Стадия А: Получение метил 2,4,6-трифторбензоацетата

Раствор 2,4,6-трифторбензолуксусной кислоты (5,00 г, 26,3 ммоль) в метаноле (25 мл) перемешивали при комнатной температуре, добавили по каплям тионилхлорид (6 мл, ~3 экв.), что вызвало повышение температуры реакционной смеси до 60°C. Реакционной смеси дали возможность остыть до комнатной температуры и ее перемешивали в течение 3 часов. Добавили воду (25 мл) с ледяным охлаждением. Смесь экстрагировали этилацетатом (2×100 мл). Объединенные органические фазы последовательно промыли водой (2×), насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и рассолом, а затем высушили (MgSO<sub>4</sub>). Концентрирование обеспечило названное соединение в виде бесцветного масла (5,38 г).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 6,68 (м, 2H), 3,72 (с, 3H), 3,66 (с, 2H).

Стадия В: Получение метил α-ацетил-2,4,6-трифторбензоацетата

К промышленно доступному тетрагидрофурановому раствору бис(триметилсилил) амида лития (1,0 М, 21,0 мл), перемешанному под атмосферой азота и охлажденному до внутренней температуры -65°C, добавляли по каплям в течение 30 минут раствор метил 2,4,6-трифторбензоацетата (т.е. продукта стадии А) (2,04 г, 10,0 ммоль), растворенного в сухом тетрагидрофуране (10 мл). Реакционную смесь дополнительно перемешивали в течение 30 минут, и затем при поддержании температуры -65°C добавили по каплям раствор свежеперегнанного ацетилхлорида (0,80 мл, 11 ммоль) в сухом тетрагидрофуране (3 мл). Реакционной смеси дали возможность медленно нагреться до комнатной температуры, и затем добавили воду (30 мл). Получившуюся в результате смесь экстрагировали этилацетатом (60 мл). Водную фазу подкислили 1 н. соляной кислотой и экстрагировали этилацетатом (60 мл). Оставили только первый этилацетатный экстракт, поскольку тонкослойный хроматографический анализ показал, что второй экстракт содержит кроме дополнительного желательного продукта явные полярные примеси. Первый этилацетатный экстракт дополнительно последовательно промыли 1 н. соляной кислотой, водой и рассолом, высушили (MgSO<sub>4</sub>) и концентрировали для обеспечения названного соединения в виде бесцветного масла (1,86 г).

<sup>1</sup>H ЯМР δ 6,69 (м, 2H), 3,7 (м, 1H и с, 3H), 1,87 (с, 3 H); минорные резонансы при 13,2 ч/млн (ppm) и 4,9 ч/млн указывали на присутствие енольного таутомера.

Стадия С: Получение 1,3-диметил-4-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-ола

К раствору метил α-ацетил-2,4,6-трифторбензоацетата (т.е. продукта стадии В) (2,46 г, 10,0 ммоль) в метаноле (15 мл) добавили метилгидразин (0,665 мл, 12,5 ммоль), и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 3 дней. Добавили водный раствор лимонной кислоты (1 М, 10 мл), и затем добавили воду (50 мл). Смесь экстрагировали этилацетатом (2×50 мл). Объединенные этилацетатные экстракты последовательно промыли водой и рассолом, высушили (MgSO<sub>4</sub>) и концентрировали с выходом твердого вещества желтого цвета. Это твердое вещество суспендировали в небольшом объеме этилацетата (~5 мл), постепенно добавляли равный объем гексанов, и суспензию перемешивали в течение 30 минут. Твердый компонент собирали на стеклоцементе, промывали небольшими порциями этилацетата/гексанов (1:1 и 1:2 об.: об.), и дали возможность высохнуть на воздухе для обеспечения твердого вещества белого цвета (1,02 г). Выпаривание маточного раствора и обработка получившегося в результате остатка небольшими объемами этилацетата и гексанов, как уже описывалось, обеспечили дополнительные 0,13 г твердого вещества, содержащих названное соединение

(всего 1,15 г). Анализ объединенных твердых веществ посредством LC/MS показал основной компонент с массой 242 (AP<sup>+</sup>) и следовый компонент, элюируя позже посредством обращенно-фазовой LC, также имеющий массу 242 (AP<sup>+</sup>), являясь таким образом региоизомером названного соединения. Явное соотношение компонентов составило 94:6.

<sup>1</sup>H ЯМР (ацетон-d<sub>6</sub>) δ 6,95 (м, 2H), 3,52 (с, 3H), 1,98 (с, 3H); резонанс 5-гидрокси не наблюдали в данном растворителе.

Стадия D: Получение 4-[[1,3-диметил-4-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-ил]окси]-3,5-дифторбензонитрила

Раствор 1,3-диметил-4-(2,4,6-трифторфенил)-1H-пиразол-5-ола (т.е. продукта стадии C) (104 мг, 0,43 ммоль) в безводном N,N-диметилформамиде (2,5 мл) охлаждали в бане с ледяной водой под атмосферой азота, и одной порцией добавили гидрид натрия (60% суспензия в минеральном масле, 20 мг, 0,46 ммоль). После 15 минут одной порцией добавили 3,4,5-трифторбензонитрил (101 мг, 0,64 ммоль). Реакционной смеси дали возможность достигнуть комнатной температуры и затем ее нагревали при 40°C в течение 2,5 часов. Добавили воду (~10 мл), и смесь экстрагировали этилацетатом (2×~10 мл). Объединенные этилацетатные экстракты последовательно промывали водой (3×10 мл) и рассолом, высушили (MgSO<sub>4</sub>) и концентрировали при пониженном давлении.

Хроматография на силикагеле (5 г), элюируя смесью гексаны-этилацетат 2:1, предоставила продукт (51 мг), содержащий названное соединение в смеси 92:8 с его региоизомером.

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,1 (м, 2H), 6,5-6,6 (м, 2H), 3,85 (с, 3H), 2,05 (с, 3H), MS: 380 amu (AP<sup>+</sup>).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 7

Получение 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина (соединение 240)

Стадия A: Получение 1-(2-бром-4-фторфенил)-2-пропанона

Раствор метоксида натрия в метаноле (25%, 34 мл, 157 ммоль) объединили с толуолом (200 мл). Затем метанол перегнали при 90°C с применением ловушки Дина-Старка. После того, как раствор охладили до 70°C, с помощью капельной воронки в течение 20 мин. добавляли растворенный в этилацетате (40 мл) 2-бром-4-фторбензолацетонитрил (21,4 г, 100 ммоль) с механическим перемешиванием. На этой стадии добавили для облегчения перемешивания объемного осадка светло-розового цвета дополнительный толуол (150 мл). Реакционную смесь влили в воду и отделили органическую фазу. Водную фазу подкислили и экстрагировали этилацетатом. Этилацетатную фазу высушили и концентрировали при пониженном давлении для обеспечения промежуточного соединения α-ацетил-2-бром-4-фторбензолацетонитрила в виде неочищенного масла.

Неочищенное масло растворили в серной кислоте (60%, 170 мл) и кипятили с обратным холодильником в течение 6,5 часов. Затем реакционную смесь экстрагировали гексанами (2×100 мл), и объединенные гексановые экстракты промыли водой и рассолом, высушили (MgSO<sub>4</sub>) и концентрировали при пониженном давлении до выхода названного соединения в виде масла желтого цвета (14,7 г), которое применяли без дополнительной очистки на стадии C.

<sup>1</sup>H ЯМР δ 7,33 (м, 1H), 7,18 (м, 1H), 7,01 (м, 1H), 3,85 (с, 2H), 2,23 (с, 3H).

Стадия B: Получение 1-хлор-3-фтор-2-изотиоцианатобензола

К раствору 2-хлор-6-фторбензоламина (5,0 г, 34 ммоль) в хлорбензоле (52 мл)

добавили дихлорангидрид монотиоугольной кислоты (тиофосген) (5,1 г, 45 ммоль) и DMF (0,27 мл). Реакционную смесь кипятили с обратным холодильником в течение 2 часов и затем концентрировали с выходом названного соединения в виде масла коричневого цвета (6,15 г), которое применяли на стадии С без дополнительной очистки.

$^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  7,18 (м, 2H), 7,07 (м, 1H).

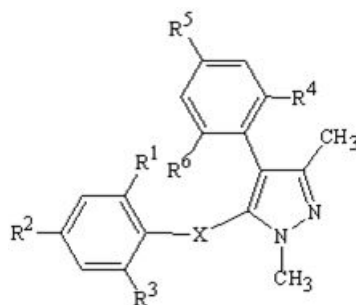
Стадия С: Получение 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

К раствору трет-бутоксиды калия (0,41 г, 3,3 ммоль) в THF (20 мл) при 0°C добавляли раствор 1-(2-бром-4-фторфенил)-2-пропанона (т.е. продукта стадии А) (0,70 г, 3,0 ммоль) в THF (10 мл) в течение 5 минут. Перемешивание продолжали в течение 1 часа и затем температуру понизили до -10°C. В течение 6 минут добавляли раствор 1-хлор-3-фтор-2-изотиоцианатобензола (т.е. продукта стадии В) (0,57 г, 3,0 ммоль) в THF (10 мл) и продолжали перемешивание в течение 15 минут. Добавили иодометан (0,54 г, 3,8 ммоль) и удалили охлаждающую баню для обеспечения реакционной смеси, содержащей промежуточное соединение  $\alpha$ -ацетил-2-бром-N-(2-хлор-6-фторфенил)-4-фторбензолэтантоамид. После 5 мин. в быстрой последовательности добавили воду (0,2 мл, 11 ммоль), ледяную уксусную кислоту (0,53 мл, 9,1 ммоль) и метилгидразин (0,81 мл, 15 ммоль), и реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 6 часов. Неочищенную реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении и очистили посредством MPLC (от 0 до 100% этилацетата в гексанах в качестве элюента) для обеспечения названного продукта, соединения настоящего изобретения, в виде твердого вещества серовато-белого цвета (0,55 г).

$^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  7,24 (м, 1H), 7,04 (м, 1H), 6,95 (м, 1H), 6,87 (м, 1H), 6,78 (м, 1H), 6,68 (м, 1H), 5,45 (д, 1H), 3,80 (с, 3H), 2,10 (с, 3H).

С помощью процедур, описанных в данном документе, вместе со способами, известными из уровня техники, можно получать соединения, раскрытые в следующих таблицах. В следующих таблицах применяются нижеупомянутые сокращения: Me означает метил, MeO означает метокси, EtO означает этокси и CN означает циано. Ввиду симметрии  $R^1$  может взаимозаменяться  $R^3$ , и  $R^4$  может взаимозаменяться  $R^6$ , если это позволяют определения  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$ .

ТАБЛИЦА 1



$R^4$  представляет собой F,  $R^5$  представляет собой H,  $R^6$  представляет собой H и X представляет собой NH.

$R^1$	$R^2$	$R^3$	$R^1$	$R^2$	$R^3$
F	H	H	F	H	F
F	F	H	F	F	F
F	CN	F	F	MeO	F
F	EtO	F	F	Cl	H
F	Cl	Cl	F	H	Cl
F	Br	H	F	H	Br
F	Cl	F	F	Br	F

	F	I	H	F	F	I
	F	I	F	F	CN	H
	F	MeO	H	F	EtO	H
	Cl	H	H	Cl	H	Cl
5	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl
	Cl	CN	Cl	Cl	MeO	Cl
	Cl	EtO	Cl	Cl	F	H
	Cl	F	F	Cl	F	Cl
	Cl	Br	H	Cl	H	Br
	Cl	Br	Br	Cl	Br	Cl
10	Cl	I	H	Cl	CN	H
	Cl	MeO	H	Cl	EtO	H
	Br	H	H	Br	F	H
	Br	Cl	H	Br	Br	H
	Br	F	F	Br	Br	F
	Br	Cl	F	Br	F	Cl
15	Br	Cl	Cl	Br	F	Br
	Br	CN	Br	Br	MeO	Br
	Br	EtO	Br	Br	CN	H
	Br	MeO	H	Br	EtO	H
	Br	I	H	I	H	H
	I	F	H	I	F	F
20	I	Cl	F	I	Cl	Cl
	Br	H	Cl	Br	H	Br
	I	H	F	I	H	Cl
	Me	H	H	Me	H	F
	Me	F	H	Me	F	F
	Me	CN	F	Me	MeO	F
25	Me	EtO	F	Me	Cl	H
	Me	Cl	Cl	Me	H	Cl
	Me	Br	H	Me	H	Br
	Me	Cl	F	Me	Br	F
	Me	I	H	Me	F	I
	Me	I	F	Me	CN	H
30	Me	MeO	H	Me	EtO	H
	Me	H	Me	Me	Cl	Me

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2-180, каждая из которых устроена так же как таблица 1 выше, за исключением того, что заголовок строки в таблице 1 (т.е. “R<sup>4</sup> представляет собой F, R<sup>5</sup> представляет собой H, R<sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой NH”) заменен соответствующим заголовком строки, показанным ниже. Например, в таблице 2 заголовком строки является “R<sup>4</sup> представляет собой F, R<sup>5</sup> представляет собой H, R<sup>6</sup> представляет собой F, и X представляет собой NH”, и R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> являются такими, как определено в таблице 1 выше. Таким образом, первая запись в таблице 2, в частности, раскрывает 4-(2,6-дифторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин).

Таблица	Заголовок строки	Таблица	Заголовок строки
2	R <sup>4</sup> представляет собой F, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой F, и X представляет собой NH.	92	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой F, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.
3	R <sup>4</sup> представляет собой F, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой NH.	93	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой F, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой O.
4	R <sup>4</sup> представляет собой F, R <sup>5</sup> представляет собой	94	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой I, R <sup>6</sup>









	MeO, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.		представляет собой Br, и X представляет собой CHON.	
5	81	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.	171	R <sup>4</sup> представляет собой Br, R <sup>5</sup> представляет собой I, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой CHON.
	82	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой O.	172	R <sup>4</sup> представляет собой Br, R <sup>5</sup> представляет собой EtO, R <sup>6</sup> представляет собой Br, и X представляет собой CHON.
10	83	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой Br, и X представляет собой O.	173	R <sup>4</sup> представляет собой Br, R <sup>5</sup> представляет собой EtO, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой CHON.
	84	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой Br, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.	174	R <sup>4</sup> представляет собой Br, R <sup>5</sup> представляет собой MeO, R <sup>6</sup> представляет собой Br, и X представляет собой CHON.
15	85	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой Br, R <sup>6</sup> представляет собой Br, и X представляет собой O.	175	R <sup>4</sup> представляет собой Br, R <sup>5</sup> представляет собой MeO, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой CHON.
	86	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой Br, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой O.	176	R <sup>4</sup> представляет собой I, R <sup>5</sup> представляет собой H, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой CHON.
20	87	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой Cl, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.	177	R <sup>4</sup> представляет собой I, R <sup>5</sup> представляет собой Cl, R <sup>6</sup> представляет собой F, и X представляет собой CHON.
	88	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой Cl, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой O.	178	R <sup>4</sup> представляет собой I, R <sup>5</sup> представляет собой Cl, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой CHON.
25	89	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой CN, R <sup>6</sup> представляет собой Cl, и X представляет собой O.	179	R <sup>4</sup> представляет собой I, R <sup>5</sup> представляет собой F, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой CHON.
	90	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой CN, R <sup>6</sup> представляет собой H, и X представляет собой O.	180	R <sup>4</sup> представляет собой I, R <sup>5</sup> представляет собой F, R <sup>6</sup> представляет собой F, и X представляет собой CHON.
30	91	R <sup>4</sup> представляет собой Cl, R <sup>5</sup> представляет собой F, R <sup>6</sup> представляет собой F, и X представляет собой O.		

### Состав/полезность

Соединение, выбранное из соединений формулы 1, их N-оксидов и солей, или смесь (т.е. композиция), содержащая соединение по меньшей мере с одним дополнительным фунгицидным соединением, как описано в кратком описании настоящего изобретения, будет в основном применяться для обеспечения фунгицидных активных ингредиентов в дополнительных композициях, т.е. составах, по меньшей мере с одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, что служит носителем. Ингредиенты состава или композиции выбираются в соответствии с физическими свойствами активных ингредиентов, способом нанесения и факторами внешней среды, такими как тип почвы, влажность и температура.

Смеси компонента (a) (т.е. по меньшей мере одного соединения формулы 1, его N-оксидов или солей) с компонентом (b) (например, выбранным из (b1)-(b46) и его солей, как описано выше) и/или одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами (т.е. инсектицидами, иными фунгицидами, нематоцидами, акарицидами, гербицидами и другими биологическими средствами) могут составлять рядом способов, включая:

(i) компонент (a), компонент (b) и/или один или несколько иных биологически активных соединений или средств могут составлять отдельно и наноситься отдельно

или наноситься одновременно в подходящем весовом соотношении, например, в виде смеси из резервуара; или

(ii) компонент (a), компонент (b) и/или один или несколько иных биологически активных соединений или средств могут составляться вместе в подходящем весовом соотношении.

Применимые составы включают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии и/или суспензии) и т.п., которые необязательно можно загущать в гели. Общими типами водных жидких композиций являются растворимый концентрат, суспензионный концентрат, капсульная суспензия, концентрированная эмульсия, микроэмульсия и суспензия. Общими типами неводных жидких композиций являются эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляная дисперсия.

Общими типами твердых композиций являются присыпки, порошки, гранулы, шарики, дробинки, таблетки, заполненные пленки (в том числе покрытия семян) и т.п., которые могут быть диспергируемыми в воде (“смачиваемыми”) или растворимыми в воде. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, особенно применимы для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулирован и дополнительно превращен в суспензию или твердый состав; в качестве альтернативы весь состав активного ингредиента может быть инкапсулирован (или “покрыт”). Инкапсуляция может контролировать или задерживать высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемая гранула объединяет преимущества как состава в виде эмульгируемого концентрата, так и сухого гранулированного состава. Сильно концентрированные композиции в основном применяются в качестве промежуточных продуктов для дальнейшего состава.

Следует отметить композицию варианта осуществления, где гранулы твердой композиции, содержащей соединение формулы 1 (или его N-оксид или соль), смешивают с гранулами твердой композиции, содержащей компонент (b). Эти смеси можно дополнительно смешивать с гранулами, содержащими дополнительные сельскохозяйственные протравители. В качестве альтернативы, два или более сельскохозяйственных протравителя (например, соединение компонента (a) (формула 1), соединение компонента (b), сельскохозяйственный протравитель, иной чем компонент (a) или (b)) можно объединять в твердой композиции из одного набора гранул, что затем смешивают с одним или несколькими наборами гранул твердых композиций, содержащих один или несколько дополнительных сельскохозяйственных протравителей. Эти смеси гранул могут быть в соответствии с общим раскрытием смеси гранул из патентной публикации PCT WO 94/24861 или более предпочтительно с идеей гомогенной смеси гранул патента США 6022552.

Распыляемые составы, как правило, разбавляют перед распылением в подходящей среде. Такие жидкие и твердые составы составляют так, чтобы они легко разбавлялись в среде для распыления, как правило, в воде. Объемы для распыления могут изменяться от около одного до нескольких тысяч литров на гектар, но типичнее находятся в диапазоне от около десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые составы могут смешиваться в резервуаре с водой или другой подходящей средой для обработки листьев посредством воздушного или наземного нанесения или для внесения в среду для выращивания растения. Жидкие и сухие составы можно отмерять непосредственно в системы капельного орошения или отмерять в борозду во время посадки. Жидкие и твердые составы могут наноситься на семена сельскохозяйственных культур и иную

желательную растительность в качестве обработки семян перед посадкой для защиты развивающихся корней и других подземных частей растения и/или листвы посредством системного поглощения.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в следующих приближительных диапазонах, которые составляют в сумме 100 процентов по весу.

	Весовой процент		
	Активный ингредиент	Разбавитель	Поверхностно-активное вещество
10 Диспергируемые в воде и растворимые в воде гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	1-50	40-99	0-50
Присыпки	1-25	70-99	0-5
Гранулы и шарики	0,001-99	5-99,999	0-15
15 Сильно концентрированные композиции	90-99	0-10	0-2

Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлозу, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактозу, сахарозу), диоксид кремния, тальк, слюду, диатомовую землю, мочевины, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описываются в Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Жидкие разбавители включают, например, воду, N,N-диметилалканамиды (например, N,N-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, N-алкилпирролидоны (например, N-метилпирролидинон), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, светлые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, глицеринтриацетат, сорбит, триацетин, ароматические углеводороды, деароматизованные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры лактатов, сложные эфиры двухосновных кислот и  $\gamma$ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такими как метанол, этанол, н-пропанол, изопропиловый спирт, н-бутанол, изобутиловый спирт, н-гексанол, 2-этилгексанол, н-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают сложные эфиры глицерина с насыщенными и ненасыщенными жирными кислотами (как правило, C6-C22), например, масла из семян и плодов растений (например, масла из оливы, клещевины, льняного семени, кунжута, кукурузы (маиса), арахиса, подсолнечника, виноградных косточек, сафлоры, семян хлопчатника, сои, рапса, кокоса и копры), жиры животного происхождения (например, говяжий жир, свиной жир, топленый свиной жир, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты могут получать гидролизом сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников, и могут очищать перегонкой. Типичные жидкие

разбавители описываются в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции настоящего изобретения часто включают одно или несколько поверхностно-активных веществ. При добавлении к жидкости поверхностно-активные вещества (также известные как “поверхностно-активные средства”), как правило, меняют, чаще всего снижают, поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества, поверхностно-активные вещества могут применяться в качестве смачивающих средств, диспергаторов, эмульгаторов или пеногасителей.

Поверхностно-активные вещества могут классифицироваться как неионные, анионные или катионные. Неионные поверхностно-активные вещества, применимые для настоящих композиций, включают без ограничений: алкоксилаты спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными) и полученные из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей; этоксилаты аминов, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированные соевое, каторовое и рапсовые масла; алкилфенолалкоксилаты, такие как октилфенолэтоксилаты, нонилфенолэтоксилаты, динонилфенолэтоксилаты и додецилфенолэтоксилаты (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); блоксополимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида, и обратные блоксополимеры, в которых концевые блоки получены из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные сложные эфиры жирных кислот и масел; этоксилированные метиловые сложные эфиры; этоксилированные тристирилфенолы (в том числе получаемые из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, такие как полиэтоксилированные сложные эфиры сорбитана и жирных кислот, полиэтоксилированные сложные эфиры сорбита и жирных кислот и полиэтоксилированные сложные эфиры глицерина и жирных кислот; иные производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как случайные сополимеры, блоксополимеры, алкидные ПЭГ (полиэтиленгликоль) смолы, привитые или гребенчатые полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (ПЭГ); сложные эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе силикона и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигликозиды и алкилполисахариды.

Применимые анионные поверхностно-активные вещества включают без ограничений: алкиларилсульфокислоты и их соли; карбоксилированные спирты или алкилфенолэтоксилаты; дифенилсульфонатные производные; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновую или янтарную кислоты или их ангидриды; олефинсульфонаты; фосфатные сложные эфиры, такие как фосфатные сложные эфиры алкоксилатов спиртов, фосфатные сложные эфиры алкилфенолалкоксилатов и фосфатные сложные эфиры стирилфенолэтоксилатов; поверхностно-активные вещества на основе белков; производные саркозина; сульфат стирилфенолового эфира; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как N,N-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированного нефтепродукта; сульфосукцинаматы и

сульфосукцинаты и их производные, такие как диалкилсульфосукцинатные соли.

Применимые катионные поверхностно-активные вещества включают без ограничений: амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как N-алкилпропандиамины, трипропилен триамины и дипропилен тетраамины, а также этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); соли аминов, такие как ацетаты аминов и соли диаминов; соли четвертичного аммония, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и аминоксиды, такие как алкилдиметиламиноксиды и бис-(2-гидроксиэтил)-алкиламиноксиды.

Также применимыми для настоящих композиций являются смеси неионных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси из неионных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и их рекомендуемые применения раскрываются во множестве опубликованных источников, в том числе McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, ежегодные американские и международные издания, опубликованные McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции настоящего изобретения могут также содержать вспомогательные вещества и добавки состава, известные специалистам в данной области в качестве вспомогательных средств состава (некоторые из которых могут рассматриваться как выполняющие также функцию твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки состава могут контролировать: pH (буферы), пенообразование во время изготовления (противовспениватели подобные полиорганосилоксанам), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие средства), вязкость (тиксотропные загустители), развитие микроорганизмов в таре (противомикробные средства), замораживание продуктов (антифризы), цвет (дисперсии красителей/пигментов), смывание (пленкообразователи или клейкие вещества), испарение (замедлители испарения) и другие свойства состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетатов, сополимер поливинилпирролидона и винилацетата, поливинильные спирты, сополимеры поливинильных спиртов и воски. Примеры вспомогательных веществ и добавок составов включают, перечисленные в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, ежегодных американских и международных изданиях, опубликованных McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co., и PCT публикации WO 03/024222.

Соединения формулы 1 и любые другие активные ингредиенты, как правило, включаются в настоящие композиции посредством растворения активного ингредиента в растворителе или посредством измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, можно получать посредством простого смешивания ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенной для применения в виде эмульгируемого концентрата, является несмешиваемым с водой, то, как правило, добавляют эмульгатор для эмульгирования растворителя, содержащего активное вещество, при разбавлении водой. Взвеси активного ингредиента с диаметрами частиц до 2000 мкм можно перемалывать мокрым способом с применением мельниц для размолла в среде для получения частиц со средними диаметрами меньше 3 мкм. Водные взвеси можно превращать в готовые суспензионные концентраты (см., например, патент США 3060084) или дополнительно обрабатывать посредством сушки

распылением для образования диспергируемых в воде гранул. Для сухих составов, как правило, требуются процессы сухого перемалывания, которые дают частицы со средними диаметрами в диапазоне 2-10 мкм. Присыпки и порошки можно получать посредством смешивания и, как правило, измельчения (таким как с помощью молотковой мельницы или струйной мельницы). Гранулы и шарики можно получать распылением активного материала на предварительно отформованные гранулированные носители или посредством методик агломерации. См. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 и следующие и WO 91/13546. Шарики можно получать, как описывается в патенте США 4172714. Диспергируемые в воде и растворимые в воде гранулы можно получать, как сообщается в патенте США 4144050, патенте США 3920442 и патенте Германии 3246493. Таблетки можно получать, как сообщается в патенте США 5180587, патенте США 5232701 и патенте США 5208030. Пленки можно получать, как сообщается в патенте Великобритании 2095558 и патенте США 3299566.

Для дополнительной информации, касающейся области составов, см. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" в Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. См. также патент США 3235361, кол. 6, строка 16 - кол. 7, строка 19 и примеры 10-41; патент США 3309192, кол. 5, строка 43 - кол. 7, строка 62 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; патент США 2891855, кол. 3, строка 66 - кол. 5, строка 17 и примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 и Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В следующих примерах все процентные соотношения приводятся по весу и все составы получают традиционными способами. Номера соединений ссылаются на соединения в таблице индексов А. Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области, применяя предыдущее описание, может использовать настоящее изобретение в его наиболее полном объеме. Следующие примеры, следовательно, расцениваются всего лишь как иллюстративные и неограничивающие никоим образом раскрытие. Процентные соотношения приводятся по весу, за исключением случаев, где указывается иное.

#### Пример А

35 Сильно концентрированный концентрат

соединение 47	49,3%
пентиопирад	49,2%
аэрогель диоксида кремния	0,5%
синтетический аморфный мелкодисперсный диоксид кремния	1,0%

40

#### Пример В

Смачиваемый порошок

соединение 81	43,0%
квиноксифен	22,0%
эфир додецилфенола и полиэтиленгликоля	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
алюмосиликат натрия	6,0%
монтмориллонит (прокаленный)	23,0%

45

#### Пример С

## Гранула

	соединение 136	7,5%
	эпоксиконазол	2,5%
5	гранулы аттапульгита (нелетучее вещество, 0,71/0,30 мм; сита U.S.S. № 25-50)	90,0%

## Пример D

## Экструдированный шарик

	соединение 144	8,0%
	спироксамин	17,0%
10	безводный сульфат натрия	10,0%
	неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
	алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
	бентонит кальция/магния	59,0%

## Пример E

## 15 Эмульгируемый концентрат

	соединение 161	5,0%
	азоксистробин	5,0%
	полиоксиэтиленсорбит гексолеат	20,0%
20	C <sub>6</sub> -C <sub>10</sub> жирной кислоты метиловый сложный эфир	70,0%

## Пример F

## Микроэмульсия

	соединение 195	3,3%
	пикоксистробин	1,7%
25	сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	30,0%
	алкилполигликозид	30,0%
	глицерилмоноолеат	15,0%
	вода	20,0%

## Пример G

## 30 Обработка семян

	соединение 238	4,00%
	ипродион	16,00%
	сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	5,00%
	кислый монтанвоск	5,00%
35	лигнинсульфонат кальция	1,00%
	блоксополимеры из полиоксиэтилена/полиоксипропилена	1,00%
	стеариловый спирт (POE 20)	2,00%
	полиорганосилан	0,20%
	красящий красный краситель	0,05%
	вода	65,75%

## Пример H

## 40 Эмульгируемый концентрат

	соединение 239	10,0%
	полиоксиэтиленсорбит гексолеат	20,0%
45	C <sub>6</sub> -C <sub>10</sub> жирной кислоты метиловый сложный эфир	70,0%

Составы, как например, таковые в таблице составов, как правило, разбавляются водой с образованием водных композиций перед нанесением. Водные композиции для непосредственных нанесений на растение или его часть (например, композиции в резервуаре распылителя), как правило, содержат по меньшей мере приблизительно 1

ч/млн или более (например, от 1 ч/млн до 100 ч/млн) фунгицидно активных соединений по настоящему изобретению.

Примеры фунгицидных соединений компонента (b) включают ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, амисулбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил, беналаксил-М, беноданил, беномил, бентиаваликарб, бентиаваликарб-изопротил, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромконазол, бупиримат, бутиобат, карбоксин, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлороталонил, хлозолинат, клотримазол, соли меди, такие как бордоская смесь (трехосновный сульфат меди), гидроксид меди и оксихлорид меди, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифенокконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол, диниконазол-М, динокап, дитианон, додеморф, додин, эдифенфос, энестробурин, эпоксиконазол, этаконазол, этабоксам, этиримол, этридиазол, фамоксадон, фенамидон, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фентин ацетат, фентин хлорид, фентин гидроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудиоксонил, флуметовер, флуморф, флуопиколид (также известный как пикобензамид), флуопирам, фторимид, флуоксастробин, флуквинконазол, флузилазол, флусульфамид, флутианил (2-[[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]тио]-2-[3-(2-метокси-фенил)-2-тиазолидинилиден]ацетонитрил), флутоланил, флутриафол, флуксапироксад, фолпет, фосетил-алюминий, фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гексаконазол, гимексазол, гуазатин, имазалил, имибенконазол, иминоктадин, иодокарб, ипконазол, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, изопротиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, манкозоб, мандипропамид, манеб, мепронил, мептилдинокап, металаксил, металаксил-М, метконазол, метасульфоккарб, метирам, метоминостробин, мепанипирим, метрафенон, миклобутанил, нафтифин, нео-азозин (метанарсонат трехвалентного железа), нуаримол, октилинон, офурас, орисастробин, оксадиксил, оксолиновую кислоту, окспокконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентиопирад, пефуразоат, фосфористую кислоту или ее соли, фталид, пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамокарб, пропамокарб гидрохлорид, пропиконазол, пропинеб, проквиназид, протиокконазол, пиракlostробин, пираметостробин, пираоксистробин, пиразофос, пирибенкарб, пирибутикарб, пирифенокс, пириметанил, пириофенон, пироквилон, пирролнитрин, квинконазол, хинометионат, квиноксифен, квинтозен, седаксан, силтиофам, симеконазол, спироксамин, стрептомицин, серу, тебуконазол, тебуфлоквин, теклофталам, текназен, тербинафин, тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиофанат, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, толклофос-метил, толилфлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлумизол, трициклазол, трифлуксистробин, трифорин, триморфамид, тритиконазол, униконазол, валидамицин, валифеналат (валифенал), винклозолин, цинеб, цирам, зоксамид, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин (BAS600), N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид, 2-бутокси-6-иодо-3-пропил-4Н-1-бензопиран-4-он, 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил]пиримидин, 4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат, N-[[

(циклопропилметокси)амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метиле  
бензолацетамид, α-(метоксиимино)-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]  
имино]метил]бензолацетамид, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-  
диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаид, N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-  
метилбензолсульфонаид, 2-[[[3-(2,6-дихлорфенил)-1-метил-2-пропен-1-илиден]амино]  
окси]метил]-α-(метоксиимино)-N-метилбензолацетамид, 1-[(2-пропенилтио)карбонил]  
-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-5-амино-1H-пиразол-3-он, этил-6-октил-[1,2,4]  
триазоло[1,5-а]пиримидин-7-иламин, пентил N-[4-[[[(1-метил-1H-тетразол-5-ил)  
фенилметиле]амино]окси]метил]-2-тиазолил]карбамат, пентил N-[6-[[[(1-метил-1H-  
тетразол-5-ил)фенилметиле]амино]окси]метил]-2-пиридинил]карбамат, 2-[(3-бром-6-  
хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид, 2-[(3-этинил-6-  
хинолинил)окси]-N-[1-(гидроксиметил)-1-метил-2-пропин-1-ил]-2-(метилтио)ацетамид,  
N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамид и  
N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-  
N-метилметанимидаид. Следует отметить предыдущий список, также исключая  
N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-  
N-метилметанимидаид. Дополнительно следует отметить предыдущий список, также  
исключая бутиобат, этаконазол, квинконазол, триаримол, 2-[(3-бром-6-хинолинил)  
окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид, 2-[(3-этинил-6-хинолинил)  
окси]-N-[1-(гидроксиметил)-1-метил-2-пропин-1-ил]-2-(метилтио)ацетамид и N-(1,1-  
диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамид.

Следует отметить в качестве фунгицидных соединений в компоненте (b) настоящей  
композиции азоксистробин, крезоксим-метил, трифлорксистробин, пиракlostробин,  
пираметостробин, пираоксистробин, пикоксистробин, димоксистробин,  
метоминостробин/феноминостробин, карбендазим, хлороталонил, квиноксифен,  
метрафенон, пириофенон, цифлуфенамид, фенпропидин, фенпропиморф, бромуконазол,  
ципроконазол, дифеноконазол, эпоксиконазол, этаконазол, фенбуконазол, флузилазол,  
флуксапироксад, гексаконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, пенконазол,  
пропиконазол, проквиназид, протиоконазол, тебуконазол, тритиконазол, фамоксадон,  
прохлораз, пентиопирад и боскалид (никобифен).

В целом для лучшего контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами  
растений (например, более низкий рабочий расход или более широкий спектр  
контролируемых патогенов растений), или управления резистентностью  
предпочтительными являются смеси из соединения формулы 1, его N-оксида или соли  
с фунгицидным соединением, выбранным из группы: азоксистробин, крезоксим-метил,  
трифлорксистробин, пиракlostробин, пираметостробин, пираоксистробин,  
пикоксистробин, димоксистробин, метоминостробин/феноминостробин, квиноксифен,  
метрафенон, цифлуфенамид, фенпропидин, фенпропиморф, ципроконазол,  
дифеноконазол, эпоксиконазол, этаконазол, флузилазол, метконазол, миклобутанил,  
пропиконазол, проквиназид, протиоконазол, пириофенон, тебуконазол, тритиконазол,  
фамоксадон и пентиопирад.

В фунгицидных композициях настоящего изобретения компонент (a) (т.е. по меньшей  
мере одно соединение, выбранное из соединений формулы 1, их N-оксидов и солей) и  
компонент (b) присутствуют в фунгицидно эффективных количествах. Весовое  
соотношение компонента (b) (т.е. одного или нескольких дополнительных фунгицидных  
соединений) к компоненту (a) составляет в целом от около 1:3000 до около 3000:1 и  
более типично от около 1:500 до около 500:1. В таблице В1 перечисляются типичные,  
более типичные и наиболее типичные диапазоны соотношений, включающие конкретные

фунгицидные соединения компонента (b). В таблицах А1-А43 и С1-С43 приводятся примеры весовых соотношений для конкретных комбинаций фунгицидных соединений. Следует отметить композиции, где весовое соотношение компонента (a) к компоненту (b) составляет от около 125:1 до около 1:125. Со многими фунгицидными соединениями компонента (b) эти композиции особенно эффективны в контроле болезней растений, вызванных патогенными грибами растений. Особенно следует отметить композиции, где весовое соотношение компонента (a) к компоненту (b) составляет от около 25:1 до около 1:25 или от около 5:1 до около 1:5. Специалист в данной области может легко определить посредством несложного проведения исследования весовые соотношения и нормы внесения фунгицидных соединений, необходимые для желательного спектра фунгицидной защиты и контроля. Будет очевидным, что включение дополнительных фунгицидных соединений в компонент (b) может расширять спектр контролируемых болезней растений сверх контролируемого спектра исключительно компонента (a).

Конкретные смеси (номера соединений ссылаются на соединения в таблице индексов А) перечисляются в таблицах А1-А43. В таблице А1 каждая строка ниже заголовков колонок “Компонент (a)” и “Компонент (b)” в частности раскрывает смесь компонента (a), который представляет собой соединение 3, и фунгицидного соединения компонента (b). Записи под заголовком “Иллюстративные соотношения” раскрывают три конкретные весовые соотношения компонента (b) к компоненту (a) для раскрываемой смеси. Например, в первой строке таблицы А1 раскрыта смесь соединения 3 с ацибензолар-S-метилом и перечислены весовые соотношения ацибензолар-S-метила к соединению 3: 1:1, 1:4 или 1:18.

Таблица А1					
	Компонент (a)	Компонент (b)	Иллюстративные соотношения(*)		
			1:1	1:4	1:18
25	соединение 3	ацибензолар-S-метил	1:1	1:4	1:18
	соединение 3	альдиморф	7:1	3:1	1:1
	соединение 3	аметоктрадин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	амисулбром	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	анилазин	22:1	8:1	4:1
30	соединение 3	азаконазол	2:1	1:2	1:4
	соединение 3	азоксистробин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	беналаксил	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	беналаксил-М	1:1	1:3	1:8
	соединение 3	беноданил	4:1	2:1	1:2
	соединение 3	беномил	11:1	4:1	1:1
35	соединение 3	бентиаваликарб	1:1	1:4	1:12
	соединение 3	бентиаваликарб-изопропил	1:1	1:4	1:12
	соединение 3	бетоксазин	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	бинапакрил	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	бифенил	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	битертанол	3:1	1:1	1:2
40	соединение 3	биксафен	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	бластицидин-S	1:4	1:12	1:30
	соединение 3	бордоская смесь (трехосновный сульфат меди)	45:1	15:1	5:1
	соединение 3	боскалид	4:1	2:1	1:2
	соединение 3	бромуконазол	3:1	1:1	1:3
45	соединение 3	бупиримат	1:3	1:10	1:30
	соединение 3	каптафол	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	каптан	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	карбендазим	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	карбоксин	4:1	2:1	1:2
	соединение 3	карпропамид	3:1	1:1	1:3

	соединение 3	хлоронеб	100:1	35:1	14:1
	соединение 3	хлороталонил	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	хлозолинат	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	клотримазол	3:1	1:1	1:3
5	соединение 3	гидроксид меди	45:1	15:1	5:1
	соединение 3	оксихлорид меди	45:1	15:1	5:1
	соединение 3	циазофамид	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	цифлуфенамид	1:2	1:6	1:24
	соединение 3	цимоксанил	1:1	1:2	1:5
10	соединение 3	ципроконазол	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	ципродинил	4:1	2:1	1:2
	соединение 3	дихлофлуанид	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	диклоцимет	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	дикломезин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	диклоран	15:1	5:1	2:1
15	соединение 3	диэтофенкарб	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	дифеноконазол	1:1	1:3	1:12
	соединение 3	дифлуметорим	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	диметиримол	1:3	1:8	1:30
	соединение 3	диметоморф	3:1	1:1	1:2
	соединение 3	димоксистробин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	диниконазол	1:1	1:3	1:8
20	соединение 3	диниконазол-М	1:1	1:3	1:12
	соединение 3	динокап	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	дитианон	5:1	2:1	1:2
	соединение 3	додеморф	7:1	3:1	1:1
	соединение 3	додин	10:1	4:1	2:1
	соединение 3	эдифенфос	3:1	1:1	1:3
25	соединение 3	энэстробурин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	эпоксиконазол	1:1	1:3	1:7
	соединение 3	этаконазол	1:1	1:3	1:7
	соединение 3	этабоксам	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	этиримол	7:1	3:1	1:1
30	соединение 3	этридиазол	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	фамоксадон	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	фенамидон	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	фенаримол	1:2	1:7	1:24
	соединение 3	фенбуконазол	1:1	1:3	1:10
	соединение 3	фенфурам	4:1	1:1	1:2
35	соединение 3	фенгексамид	10:1	4:1	2:1
	соединение 3	феноксанил	15:1	4:1	1:1
	соединение 3	фенпиклонил	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	фенпропидин	7:1	2:1	1:1
	соединение 3	фенпропиморф	7:1	2:1	1:1
	соединение 3	фенпиразамин	3:1	1:1	1:3
40	соединение 3	соль фентина, такая как фентин ацетат, фентин хлорид или фентин гидроксид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	фербам	30:1	10:1	4:1
	соединение 3	феримзон	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	флуазинам	3:1	1:1	1:2
	соединение 3	флудиоксонил	2:1	1:1	1:4
45	соединение 3	флуметовеер	3:1	1:1	1:2
	соединение 3	флуморф	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	флуопиколд	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	флуопирам	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	фторимид	37:1	14:1	5:1
	соединение 3	флуоксастробин	1:1	1:2	1:6

	соединение 3	флуквинконазол	1:1	1:2	1:4
	соединение 3	флузилазол	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	флусульфамид	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	флутуанил	1:1	1:2	1:6
5	соединение 3	флутоланил	4:1	1:1	1:2
	соединение 3	флутриафол	1:1	1:2	1:4
	соединение 3	флуксапироксад	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	фолпет	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	фосетил-алюминий	30:1	12:1	5:1
10	соединение 3	фуберидазол	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	фуралаксил	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	фураметпир	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	гуазатин	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	гексаконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	гимексазол	75:1	25:1	9:1
15	соединение 3	имазалил	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	имибенконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	иминоктадин	15:1	4:1	1:1
	соединение 3	иодокарб	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	ипконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	ипробенфос	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	ипродион	15:1	5:1	2:1
20	соединение 3	ипроваликарб	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	изопроотиолан	45:1	15:1	5:1
	соединение 3	изопиразам	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	изотианил	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	касугамицин	1:2	1:7	1:24
	соединение 3	крезоксим-метил	2:1	1:1	1:4
25	соединение 3	манкозеп	22:1	7:1	3:1
	соединение 3	мандипропамид	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	манеб	22:1	7:1	3:1
	соединение 3	мепанипирим	6:1	2:1	1:1
	соединение 3	мепронил	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	мептилдинокап	2:1	1:1	1:3
30	соединение 3	металаксил	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	металаксил-М	1:1	1:4	1:12
	соединение 3	метконазол	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	метасульфокарб	15:1	5:1	2:1
35	соединение 3	метирам	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	метоминостробин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	метрафенон	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	миклобутанил	1:1	1:3	1:8
	соединение 3	нафтифин	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	нео-азозин (метанарсонат трехвалентного железа)	15:1	5:1	2:1
40	соединение 3	нуаримол	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	октилинон	15:1	4:1	1:1
	соединение 3	офурас	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	орисастробин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	оксадиксил	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	оксолиновая кислота	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	окспоконазол	1:1	1:2	1:5
45	соединение 3	оксикарбоксин	4:1	1:1	1:2
	соединение 3	окситетрациклин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	пефуразоат	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	пенконазол	1:2	1:6	1:15
	соединение 3	пенцикурон	11:1	4:1	2:1

	соединение 3	пенфлуфен	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	пентиопирад	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	фосфористая кислота или ее соль	15:1	6:1	2:1
	соединение 3	фталид	15:1	6:1	2:1
5	соединение 3	пикоксистробин	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	пипералин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	полиоксин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	пробеназол	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	прохлораз	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	процимидон	11:1	4:1	2:1
10	соединение 3	пропамокарб или пропамокарб гидрохлорид	10:1	4:1	2:1
	соединение 3	пропиконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	пропинеб	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	проквиназид	1:1	1:3	1:12
	соединение 3	протиокарб	3:1	1:1	1:3
15	соединение 3	протиоконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	пираклостробин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	пираметостробин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	пираоксистробин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	пиразофос	15:1	4:1	1:1
	соединение 3	пирибенкарб	4:1	1:1	1:2
20	соединение 3	пирибутикарб	15:1	4:1	1:1
	соединение 3	пирифенокс	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	пириметанил	3:1	1:1	1:2
	соединение 3	пириофенон	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	пироквилон	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	пирролнитрин	15:1	5:1	2:1
25	соединение 3	квинконазол	1:1	1:2	1:4
	соединение 3	хинометионат	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	квиноксифен	1:1	1:2	1:6
	соединение 3	квинтозен	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	силтиофам	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	симеконазол	1:1	1:2	1:5
30	соединение 3	спироксамин	5:1	2:1	1:2
	соединение 3	стрептомицин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	сера	75:1	25:1	9:1
	соединение 3	тебуконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	тебуфлоквин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	теклофалам	15:1	5:1	2:1
35	соединение 3	текназен	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	тербинафин	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	тетраконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	тиабендазол	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	тифлузамид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	тиофанат	11:1	4:1	2:1
40	соединение 3	тиофанат-метил	11:1	4:1	2:1
	соединение 3	тирам	37:1	14:1	5:1
	соединение 3	тиадинил	2:1	1:1	1:3
	соединение 3	толклофос-метил	37:1	14:1	5:1
	соединение 3	толилфлуанид	15:1	5:1	2:1
45	соединение 3	триадимефон	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	триадименол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	триаримол	1:2	1:7	1:24
	соединение 3	триазоксид	15:1	5:1	2:1
	соединение 3	трициклазол	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	тридеморф	7:1	2:1	1:1

5	соединение 3	трифлуксистробин	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	трифлумизол	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	трифорин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	триморфамид	7:1	2:1	1:2
	соединение 3	тритриконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	униконазол	1:1	1:2	1:5
	соединение 3	валидамицин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	валифеналат	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	винклозолин	15:1	6:1	2:1
10	соединение 3	цинеб	37:1	14:1	5:1
	соединение 3	цирам	37:1	14:1	5:1
	соединение 3	зоксамид	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4] триазоло [1,5-а]пиримидин	1:1	1:2	1:6
15	соединение 3	N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид	2:1	1:1	1:4

20	соединение 3	2-бутокси-6-иодо-3-пропил-4Н-1-бензопиран-4-он	1:1	1:3	1:12
	соединение 3	3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил]пиридин	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	N-[[циклопропилметокси]амино] [6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метилбензоацетамид	1:2	1:7	1:24
25	соединение 3	α-[метоксиимино]-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензоацетамид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-метилбензолсульфонаид	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	2-[[[3-(2,6-дихлорфенил)-1-метил-2-пропен-1-илден]амино]окси]метил]-α-(метоксиимино)-N-метилбензоацетамид	3:1	1:1	1:3

30	соединение 3	пентил N-[4-[[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-тиазолил]карбамат	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	пентил N-[6-[[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-пиридинил]карбамат	3:1	1:1	1:3
	соединение 3	2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид	2:1	1:1	1:4
35	соединение 3	2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-N-[1-(гидроксииметил)-1-метил-2-пропин-1-ил]-2-(метилтио)ацетамид	2:1	1:1	1:4
	соединение 3	N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамид	2:1	1:1	1:4

(\*) Соотношения компонента (b) относительно компонента (a) по весу.

Каждая из таблиц А2-А43 устроена так же, как таблица А1 выше, за исключением того, что записи под заголовком колонки “Компонент (a)” заменяются соответствующей записью колонки компонента (a), показанной ниже. Таким образом, например, в таблице А2 все записи под заголовком колонки “Компонент (a)” перечисляют “соединение 7”, и в первой строке под заголовками колонок в таблице А2 в частности раскрывают смесь соединения 7 с ацибензолар-S-метилом. Таблицы А3-А43 устроены подобным образом.

Номер таблицы	Запись колонки компонента (a)	Номер таблицы	Запись колонки компонента (a)
А2	соединение 7	А23	соединение 252
А3	соединение 8	А24	соединение 253
А4	соединение 13	А25	соединение 254
А5	соединение 17	А26	соединение 257

A6	соединение 40	A27	соединение 258
A7	соединение 47	A28	соединение 259
A8	соединение 81	A29	соединение 260
A9	соединение 82	A30	соединение 261
A10	соединение 122	A31	соединение 262
A11	соединение 136	A32	соединение 263
A12	соединение 143	A33	соединение 264
A13	соединение 144	A34	соединение 265
A14	соединение 161	A35	соединение 266
A15	соединение 195	A36	соединение 267
A16	соединение 238	A37	соединение 268
A17	соединение 239	A38	соединение 269
A18	соединение 240	A39	соединение 270
A19	соединение 241	A40	соединение 271
A20	соединение 244	A41	соединение 273
A21	соединение 245	A42	соединение 275
A22	соединение 247	A43	соединение 276

В таблице В1 перечисляются конкретные комбинации соединения компонента (b) с компонентом (a), иллюстрирующие смеси, композиции и способы настоящего изобретения. В первой колонке таблицы В1 перечисляются конкретные соединения компонента (b) (например, “ацибензолар-S-метил” в первой строке). Во второй, третьей и четвертой колонках таблицы В1 преречисляются диапазоны весовых соотношений для норм, в которых соединение компонента (b), как правило, наносится на выращенную в поле сельскохозяйственную культуру относительно компонента (a) (например, “от 2:1 до 1:180” ацибензолар-S-метила относительно компонента (a) по весу). Таким образом, например, в первой строке таблицы В1 в частности раскрывают комбинацию ацибензолар-S-метила с компонентом (a), которую, как правило, наносят в весовом соотношении от 2:1 до 1:180. Остальные строки таблицы В1 должны толковаться подобным образом. Особо следует отметить композицию, содержащую смесь любого одного из соединений, перечисленных в варианте осуществления 45, в качестве компонента (a) с соединениями, перечисленными в колонке компонента (b) таблицы В1 согласно весовым соотношениям, раскрытым в таблице В1. Таким образом, таблица В1 дополняет конкретные соотношения, раскрытые в таблицах А1-А43, диапазонами соотношений для этих комбинаций.

Компонент (b)	Типичное весовое соотношение	Более типичное весовое соотношение	Наиболее типичное весовое соотношение
ацибензолар-S-метил	от 2:1 до 1:180	от 1:1 до 1:60	от 1:1 до 1:18
альдиморф	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
аметоктрадин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
амисулбром	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
анилазин	от 90:1 до 2:1	от 30:1 до 4:1	от 22:1 до 4:1
азаконазол	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
азоксистробин	от 9:1 до 1:12	от 3:1 до 1:4	от 3:1 до 1:3
беналаксил	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
беналаксил-М	от 4:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:8
беноданил	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
беномил	от 45:1 до 1:4	от 15:1 до 1:1	от 11:1 до 1:1
бентиаваликарб или бентиаваликарб-изопропил	от 2:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:12
бетоксазин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
бинапакрил	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
бифенил	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
битертанол	от 15:1 до 1:5	от 5:1 до 1:2	от 3:1 до 1:2

биксафен	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
бластицидин-S	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:4 до 1:30
боскалид	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2

5	бромуконазол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	бупиримат	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:3 до 1:30
	каптафол	от 90:1 до 1:4	от 30:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1
	каптан	от 90:1 до 1:4	от 30:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1
	карбендазим	от 45:1 до 1:4	от 15:1 до 1:2	от 11:1 до 2:1
10	карбоксин	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
	карпропамид	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	хлоронеб	от 300:1 до 2:1	от 100:1 до 4:1	от 100:1 до 14:1
	хлороталонил	от 90:1 до 1:4	от 30:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1
	хлозолинат	от 45:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1	от 11:1 до 2:1
15	клотримазол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	соли меди, такие как бордоская смесь (трехосновный сульфат меди), оксихлорид меди, сульфат меди и гидроксид меди	от 450:1 до 1:1	от 150:1 до 4:1	от 45:1 до 5:1
	циазофамид	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	цифлуфенамид	от 1:1 до 1:90	от 1:2 до 1:30	от 1:2 до 1:24
	цимоксанил	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
20	ципроконазол	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	ципродинил	от 22:1 до 1:9	от 7:1 до 1:3	от 4:1 до 1:2
	дихлофлуанид	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	диклоцимет	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	дикломезин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3

25	диклоран	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	диэтофенкарб	от 22:1 до 1:9	от 7:1 до 1:3	от 7:1 до 1:2
	дифеноконазол	от 4:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:12
	дифлуметорим	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	диметиримол	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:3 до 1:30
30	диметоморф	от 9:1 до 1:6	от 3:1 до 1:2	от 3:1 до 1:2
	димоксистробин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	диниконазол	от 3:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:8
	диниконазол М	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:1 до 1:12
	динокап	от 7:1 до 1:9	от 2:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
35	дитианон	от 15:1 до 1:4	от 5:1 до 1:2	от 5:1 до 1:2
	додеморф	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
	додин	от 30:1 до 1:2	от 10:1 до 2:1	от 10:1 до 2:1
	эдифенфос	от 30:1 до 1:9	от 10:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	энестробурин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
40	эпоксиконазол	от 3:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:7
	этаконазол	от 3:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:7
	этабоксам	от 7:1 до 1:9	от 2:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	этиримол	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
	этридиазол	от 30:1 до 1:9	от 10:1 до 1:3	от 7:1 до 1:2
45	фамоксадон	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	фенамидон	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	фенаримол	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:2 до 1:24

45	фенбуконазол	от 3:1 до 1:30	от 1:1 до 1:10	от 1:1 до 1:10
	фенфурам	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
	фенгексамид	от 30:1 до 1:2	от 10:1 до 2:1	от 10:1 до 2:1
	феноксанил	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 1:1
	фенпиклонил	от 75:1 до 1:9	от 25:1 до 1:3	от 15:1 до 2:1
	фенпропидин	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
	фенпропиморф	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
	фенпиразамин	от 100:1 до 1:100	от 10:1 до 1:10	от 3:1 до 1:3

	соль фентина, такая как ацетат, хлорид или гидроксид	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	фербам	от 300:1 до 1:2	от 100:1 до 2:1	от 30:1 до 4:1
	феримзон	от 30:1 до 1:5	от 10:1 до 1:2	от 7:1 до 1:2
5	флуазинам	от 22:1 до 1:5	от 7:1 до 1:2	от 3:1 до 1:2
	флудиоксонил	от 7:1 до 1:12	от 2:1 до 1:4	от 2:1 до 1:4
	флуметовер	от 9:1 до 1:6	от 3:1 до 1:2	от 3:1 до 1:2
	флуморф	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	флуопиколоид	от 3:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	флуопирам	от 15:1 до 1:90	от 5:1 до 1:30	от 3:1 до 1:3
10	фторомид	от 150:1 до 2:1	от 50:1 до 4:1	от 37:1 до 5:1
	флуоксастробин	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	флуквинконазол	от 4:1 до 1:12	от 1:1 до 1:4	от 1:1 до 1:4
	флузилазол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	флусульфамид	от 90:1 до 1:2	от 30:1 до 2:1	от 15:1 до 2:1
15	флутинил	от 7:1 до 1:36	от 2:1 до 1:12	от 1:1 до 1:6
	флутоланил	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
	флутриафол	от 4:1 до 1:12	от 1:1 до 1:4	от 1:1 до 1:4
	флуксапироксад	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	фолпет	от 90:1 до 1:4	от 30:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1
	фосетил-алюминий	от 225:1 до 2:1	от 75:1 до 5:1	от 30:1 до 5:1
20	фуберидазол	от 45:1 до 1:4	от 15:1 до 1:2	от 11:1 до 2:1
	фуралаксил	от 15:1 до 1:45	от 5:1 до 1:15	от 1:1 до 1:6
	фураметпир	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	гуазатин или иминоктадин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	гексаконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	гимексазол	от 225:1 до 2:1	от 75:1 до 4:1	от 75:1 до 9:1
25	имазалил	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
	имибенконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	иодокарб	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	ипконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	ипробенфос	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	ипродион	от 120:1 до 1:2	от 40:1 до 2:1	от 15:1 до 2:1
30	ипроваликарб	от 9:1 до 1:9	от 3:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	изопротиолан	от 150:1 до 2:1	от 50:1 до 4:1	от 45:1 до 5:1
	изопиразам	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	изотианил	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	касугамицин	от 7:1 до 1:90	от 2:1 до 1:30	от 1:2 до 1:24
35	крзоксим-метил	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	манкозэб	от 180:1 до 1:3	от 60:1 до 2:1	от 22:1 до 3:1
	мандипропамид	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	манеб	от 180:1 до 1:3	от 60:1 до 2:1	от 22:1 до 3:1
	мепанипирим	от 18:1 до 1:3	от 6:1 до 1:1	от 6:1 до 1:1
	мепронил	от 7:1 до 1:36	от 2:1 до 1:12	от 1:1 до 1:6
	мепилдинокап	от 7:1 до 1:9	от 2:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
40	металаксил	от 15:1 до 1:45	от 5:1 до 1:15	от 1:1 до 1:6
	металаксил-М	от 7:1 до 1:90	от 2:1 до 1:30	от 1:1 до 1:12
	метконазол	от 3:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	метасульфокارب	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 1:1
	метирам	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 1:1
	метоминостробин	от 9:1 до 1:12	от 3:1 до 1:4	от 3:1 до 1:3
45	метрафенон	от 6:1 до 1:12	от 2:1 до 1:4	от 2:1 до 1:4
	миклобутанил	от 5:1 до 1:26	от 1:1 до 1:9	от 1:1 до 1:8
	нафтифин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	нео-азозин (метанарсонат трехвалентного железа)	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	нуаримол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3

октилинон	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 1:1
офурас	от 15:1 до 1:45	от 5:1 до 1:15	от 1:1 до 1:6
орисастробин	от 9:1 до 1:12	от 3:1 до 1:4	от 3:1 до 1:3
оксадиксил	от 15:1 до 1:45	от 5:1 до 1:15	от 1:1 до 1:6

5	оксолиновая кислота	от 30:1 до 1:9	от 10:1 до 1:3	от 7:1 до 1:2
	окспокназол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	оксикарбоксин	от 18:1 до 1:6	от 6:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
	окситетрациклин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	пефуразоат	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
10	пенконазол	от 1:1 до 1:45	от 1:2 до 1:15	от 1:2 до 1:15
	пенцикурон	от 150:1 до 1:2	от 50:1 до 2:1	от 11:1 до 2:1
	пенфлуфен	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	пентиопирад	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	фосфористая кислота или ее соли	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
15	фталид	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	пикоксистробин	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
	пипералин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	полиоксин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	пробеназол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
20	прохлораз	от 22:1 до 1:4	от 7:1 до 1:1	от 7:1 до 1:2
	процимидон	от 45:1 до 1:3	от 15:1 до 1:1	от 11:1 до 2:1
	пропамокарб или пропамокарб гидрохлорид	от 30:1 до 1:2	от 10:1 до 2:1	от 10:1 до 2:1
	пропиконазол	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
	пропиниб	от 45:1 до 1:2	от 15:1 до 2:1	от 11:1 до 2:1
25	проквиназид	от 3:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:12
	протиокарб	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	протиокназол	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
	пираклостробин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	пираметостробин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
30	пираоксистробин	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	пиразофос	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 1:1
	пирибенкарб	от 15:1 до 1:6	от 5:1 до 1:2	от 4:1 до 1:2
	пирифенокс	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	пириметанил	от 30:1 до 1:6	от 10:1 до 1:2	от 3:1 до 1:2
35	пириофенон	от 6:1 до 1:12	от 2:1 до 1:4	от 2:1 до 1:4
	пироквилон	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	пирролнитрин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	квинконазол	от 4:1 до 1:12	от 1:1 до 1:4	от 1:1 до 1:4
	хинометионат	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
40	квиноксифен	от 4:1 до 1:18	от 1:1 до 1:6	от 1:1 до 1:6
	квинтозен	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	силтиофам	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	симеконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	спироксамин	от 22:1 до 1:4	от 7:1 до 1:2	от 5:1 до 1:2
45	стрептомицин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	сера	от 300:1 до 3:1	от 100:1 до 9:1	от 75:1 до 9:1
	тебуконазол	от 7:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 1:1 до 1:5
	тебуфлуквин	от 100:1 до 1:100	от 10:1 до 1:10	от 3:1 до 1:3
	теклофгалам	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
45	текназен	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	тербинафин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	тетраконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	тиабендазол	от 45:1 до 1:4	от 15:1 до 1:2	от 11:1 до 2:1
	тифлузамид	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	тиофанат	от 45:1 до 1:3	от 15:1 до 2:1	от 11:1 до 2:1

	тиофанат-метил	от 45:1 до 1:3	от 15:1 до 2:1	от 11:1 до 2:1
	тирам	от 150:1 до 1:2	от 50:1 до 2:1	от 37:1 до 5:1
	тиадинил	от 12:1 до 1:9	от 4:1 до 1:3	от 2:1 до 1:3
	толклофос-метил	от 150:1 до 1:2	от 50:1 до 2:1	от 37:1 до 5:1
5	толилфлуанид	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	триадимефон	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	триадименол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	триаримол	от 3:1 до 1:90	от 1:1 до 1:30	от 1:2 до 1:24
	триазоксид	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 15:1 до 2:1
	трициклазол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
10	тридеморф	от 30:1 до 1:3	от 10:1 до 1:1	от 7:1 до 1:1
	трифлуксистеробин	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	трифлумизол	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	трифорин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
	триморфамид	от 45:1 до 1:9	от 15:1 до 1:3	от 7:1 до 1:2
	тритриконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
	униконазол	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:5
15				
	валидамацин	от 150:1 до 1:36	от 50:1 до 1:12	от 3:1 до 1:3
	валифеналат	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	винклозолин	от 120:1 до 1:2	от 40:1 до 2:1	от 15:1 до 2:1
	цинеб	от 150:1 до 1:2	от 50:1 до 2:1	от 37:1 до 5:1
	цирам	от 150:1 до 1:2	от 50:1 до 2:1	от 37:1 до 5:1
20	зоксамид	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]триазоло-[1,5-а]пиримидин	от 15:1 до 1:36	от 5:1 до 1:12	от 1:1 до 1:6
	N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]-бутанамид	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
25	N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	2-бутоксид-6-йодо-3-пропил-4Н-1-бензопиран-4-он	от 3:1 до 1:36	от 1:1 до 1:12	от 1:1 до 1:12
	3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолонил]пиридин	от 15:1 до 1:9	от 5:1 до 1:3	от 3:1 до 1:3
30	N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанидамид	от 20:1 до 1:20	от 8:1 до 1:8	от 3:1 до 1:3
	4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат	от 6:1 до 1:18	от 2:1 до 1:6	от 2:1 до 1:4
	N-[[циклопропилметокси]амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метилбензолацетамид	от 1:1 до 1:90	от 1:2 до 1:30	от 1:2 до 1:24
35	α-[метоксиимино]-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензолацетамид	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанидамид	от 15:1 до 1:18	от 5:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-метилбензолсульфонамид	от 15:1 до 1:18	от 5:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
40	2-[[[3-(2,6-дихлорфенил)-1-метил-2-пропен-1-илиден]амино]окси]метил]-α-(метоксиимино)-N-метилбензолацетамид	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	пентил N-[4-[[[1-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенил]метил]амино]окси]метил]-2-тиазолилкарбамат	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
	пентил N-[6-[[[1-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенил]метил]амино]окси]метил]-2-пиридинилкарбамат	от 9:1 до 1:18	от 3:1 до 1:6	от 3:1 до 1:3
45	2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамид	от 5:1 до 1:22	от 2:1 до 1:8	от 2:1 до 1:4
	2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-N-[1-(гидроксиметил)-1-метил-2-пропин-1-ил]-2-(метилтио)ацетамид	от 5:1 до 1:22	от 2:1 до 1:8	от 2:1 до 1:4
	N-(1,1-диметил-2-бутин-1-ил)-2-[(3-этинил-6-хинолинил)окси]-2-(метилтио)ацетамид	от 5:1 до 1:22	от 2:1 до 1:8	от 2:1 до 1:4

Как уже отмечалось, настоящее изобретение включает варианты осуществления где в композиции, содержащей компоненты (a) и (b), компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение из каждой из двух групп, выбранное из (b1)-(b46). В таблицах С1-С43 перечисляются конкретные смеси (номера соединений ссылаются на соединения в таблице индексов А) для иллюстрации вариантов осуществления, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение из каждой из двух групп, выбранное из (b1)-(b46). В таблице С1 в каждой строке под заголовками колонок “Компонент (a)” и “Компонент (b)” в частности раскрывается смесь компонента (a), который представляет собой соединение 3, по меньшей мере с двумя фунгицидными соединениями компонента (b). Записи под заголовком “Иллюстративные соотношения” раскрывают три конкретные весовые соотношения компонента (a) к каждому фунгицидному соединению компонента (b) в последовательности касательно раскрываемой смеси. Например, в первой строке раскрывается смесь соединения 3 с ципроконазолом и азоксистробинном, и перечисляются весовые соотношения соединения 3 к ципроконазолу и к азоксистробину: 1:1:1, 2:1:1 или 3:1:1.

Таблица С1						
Компонент (a)	Компонент (b)			Иллюстративные соотношения(*)		
соединение 3	ципроконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
соединение 3	ципроконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	ципроконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	ципроконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
соединение 3	ципроконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
соединение 3	дифеноконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
соединение 3	дифеноконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
соединение 3	дифеноконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
соединение 3	дифеноконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2

	соединение 3	дифеноконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	дифеноконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	дифеноконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	дифеноконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
5	соединение 3	эпоксиконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
10	соединение 3	эпоксиконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
	соединение 3	эпоксиконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
15	соединение 3	эпоксиконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
20	соединение 3	эпоксиконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	эпоксиконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	эпоксиконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	метконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
25	соединение 3	метконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
30	соединение 3	метконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
	соединение 3	метконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
35	соединение 3	метконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	метконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	метконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	метконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
40	соединение 3	миклобутанил	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
45	соединение 3	миклобутанил	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
	соединение 3	миклобутанил	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2

	соединение 3	миклобутанил	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
5	соединение 3	миклобутанил	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	миклобутанил	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	миклобутанил	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	миклобутанил	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	протиоконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
10	соединение 3	протиоконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
15	соединение 3	протиоконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
	соединение 3	протиоконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
20	соединение 3	протиоконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	протиоконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	протиоконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
25	соединение 3	протиоконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	тебуконазол	азоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	крезоксим-метил		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	пикоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	пираклостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
30	соединение 3	тебуконазол	пираметостробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	пираоксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	трифлуксистробин		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	биксафен		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	боскалид		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	цифлуфенамид		1:2:1	2:2:1	3:2:1
35	соединение 3	тебуконазол	флуопирам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	изопиразам		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	метрафенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	пентиопирад		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	проквиназид		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	пириофенон		1:1:2	2:1:2	3:1:2
40	соединение 3	тебуконазол	квиноксифен		1:1:1	2:1:1	3:1:1
	соединение 3	тебуконазол	седаксан		1:1:2	2:1:2	3:1:2
	соединение 3	тебуконазол	пикоксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	соединение 3	тебуконазол	трифлуксистробин	проквиназид	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
	(*) Соотношения компонента (а) относительно компонента (b) последовательно, по весу.						

45 Каждая из таблиц C2-C43 устроена так же, как таблица C1 выше, за исключением того, что записи под заголовком колонки “Компонент (а)” заменяются соответствующей записью колонки компонента (а), показанной ниже. Таким образом, например, в таблице C2 все записи под заголовком колонки “Компонент (а)” перечисляют “соединение 7”, и в первой строке под заголовками колонки в таблице C2 в частности раскрывается

смесь соединения 7 с ципроконазолом и азоксистробином и иллюстративные весовые соотношения 1:1:1, 2:1:1 и 3:1:1 соединения 7:ципроконазола:азоксистробина. Таблицы C3-C43 устроены подобным образом.

Номер таблицы	Запись колонки компонента (a)	Номер таблицы	Запись колонки компонента (a)
C2	соединение 7	C23	соединение 252
C3	соединение 8	C24	соединение 253
C4	соединение 13	C25	соединение 254
C5	соединение 17	C26	соединение 257
C6	соединение 40	C27	соединение 258
C7	соединение 47	C28	соединение 259
C8	соединение 81	C29	соединение 260
C9	соединение 82	C30	соединение 261
C10	соединение 122	C31	соединение 262
C11	соединение 136	C32	соединение 263
C12	соединение 143	C33	соединение 264
C13	соединение 144	C34	соединение 265
C14	соединение 161	C35	соединение 266
C15	соединение 195	C36	соединение 267
C16	соединение 238	C37	соединение 268
C17	соединение 239	C38	соединение 269
C18	соединение 240	C39	соединение 270
C19	соединение 241	C40	соединение 271
C20	соединение 244	C41	соединение 273
C21	соединение 245	C42	соединение 275
C22	соединение 247	C43	соединение 276

Следует отметить композицию настоящего изобретения, содержащую соединение формулы 1 (или его N-оксид или соль) по меньшей мере с одним другим фунгицидным соединением, которое имеет отличающийся участок приложения действия от соединения формулы 1. В определенных случаях комбинация по меньшей мере с одним другим фунгицидным соединением, имеющим подобный спектр контроля, но отличающийся участок приложения действия, будет особо предпочтительной для управления резистентностью. Таким образом, композиция настоящего изобретения может преимущественно содержать по меньшей мере одно фунгицидное активное соединение, выбранное из группы, состоящей из (b1)-(b46), как описано выше, имеющее подобный спектр контроля, но отличающийся участок приложения действия.

Композиции компонента (a) или компонента (a) с компонентом (b) можно дополнительно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами, в том числе инсектицидами, нематоцидами, бактерицидами, акарицидами, гербицидами, антидотами гербицидов, регуляторами роста, такими как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы укоренения, хемотренизаторами, химическими сигнальными веществами, репеллентами, аттрактантами, феромонами, стимуляторами питания, питательными веществами растений, иными биологически активными соединениями или энтомопатогенными бактериями, вирусами или грибами для образования многокомпонентного пестицида, что дает даже более широкий спектр сельскохозяйственной защиты. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей фунгицидно эффективное количество компонента (a) или смеси компонента (a) и компонента (b) и биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства, и может дополнительно содержать по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или

жидкого разбавителя. Иные биологически активные соединения или средства также можно отдельно составлять в композиции, содержащие по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого или жидкого разбавителя. Для композиций настоящего изобретения одно или несколько иных биологически активных соединений или средств можно составлять вместе с одним или обоими компонентами (а) и (б) с образованием премикса, или одно или несколько иных биологически активных соединений или средств можно составлять отдельно от компонентов (а) и (б), и составы комбинируют вместе перед нанесением (например, в резервуаре распылителя) или, в качестве альтернативы, наносят один за другим.

Примеры таких биологически активных соединений или средств, с которыми можно составлять композиции из компонента (а) или компонента (а) с компонентом (б), представляют собой: инсектициды, такие как абамектин, ацефат, ацетамиприд, ацетопрол, акринатрин, альдикарб, амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, бупрофезин, карбофуран, картап, хинометионат, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорантранилипид, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хлоробензилат, кромафенозид, клотианидин, циантранилипид, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, дикофол, диелдрин, диенохлор, дифлубензурон, димефлутрин, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этоксазол, фенамифос, феназаквин, фенбутатин оксид, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенпироксимат, фенвалерат, фипронил, флониамид, флубендиамид, флуцитринат, тау-флювалинат, флуфенерим, флуфеноксурон, фонофос, галофенозид, гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметилнон, имициафос, имидаклоприд, индосакарб, изофенфос, люфенурон, малатион, меперфлутрин, метафлумизон, метальдегид, метамидофос, метидатион, метомил, метопрен, метоксифен, метоксифенозид, метофлутрин, милбемицин оксим, монокротофос, никотин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, новифлумурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, фонат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пропаргит, протиокарб, протрифенбут, пиметрозин, пирафлупрол, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирифлуквиназон, пирипрол, пирипроксифен, ротенон, рианодин, спинеторам, спиносид, спироциклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, сульпрофос, тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрафлорвинфос, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон; нематоциды, такие как альдикарб, имициафос, оксамил и фенамифос; бактерициды, такие как стрептомицин; акарициды, такие как амитраз, хинометионат, хлоробензилат, циенопирафен, цигексатин, дикофол, диенохлор, этоксазол, феназаквин, фенбутатин оксид, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад; и биологические средства, в том числе энтомопатогенные бактерии, такие как *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* и инкапсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis* (например, Cellcap, MPV, MPVII); энтомопатогенные грибы, такие как зеленый мускардинный гриб; и энтомопатогенный вирус, в том числе бакуловирус, нуклеополиэдровирус (NPV), такой как HzNPV, AfNPV; и вирус гранулеза (GV), такой как CpGV.

Общие ссылки для этих сельскохозяйственных протравителей (т.е. инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов, гербицидов и биологических средств) включают *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council,

Farnham, Surrey, U.K., 2003 и The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для вариантов осуществления, где применяются один или несколько из этих различных соучастников по смеси, весовое соотношение этих различных соучастников по смеси (всего) к компоненту (а) или к смеси компонента (а) с компонентом (б), составляет, как правило, от около 1:3000 до около 3000:1. Следует отметить весовые соотношения от около 1:100 до около 3000:1 или от около 1:30 до около 300:1 (например, соотношения от около 1:1 до около 30:1). Будет очевидно, что включение этих дополнительных компонентов может расширять спектр контролируемых болезней сверх контролируемого спектра компонентом (а) или смесью из компонента (а) с компонентом (б).

Соединения компонента (а) и/или их комбинации с соединениями компонента (б) и/или одним или несколькими иными биологически активными соединениями или средствами могут наноситься на растения, генетически трансформированные для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксина *Bacillus thuringiensis*). Эффект экзогенно наносимого настоящего компонента (а) отдельно или в комбинации с компонентом (б) может быть синергическим с экспрессируемыми белками-токсинами.

Следует отметить комбинацию или композицию, содержащую компонент (а) или компоненты (а) и (б), как описывается в кратком описании настоящего изобретения, дополнительно содержащую по меньшей мере одно соединение или средство для контроля беспозвоночных вредителей (например, инсектицид, акарицид). Особо следует отметить композицию, содержащую компонент (а) и по меньшей мере одно (т.е. одно или несколько) соединение или средство для контроля беспозвоночных вредителей, которые затем можно последовательно комбинировать с компонентом (б) для обеспечения композиции, содержащей компоненты (а) и (б) и один или несколько соединений или средств для контроля беспозвоночных вредителей. В качестве альтернативы без предварительного смешивания с компонентом (б) биологически эффективное количество композиции, содержащей компонент (а) по меньшей мере с одним средством для контроля беспозвоночных вредителей, может наноситься на растение или семя растения (непосредственно или через окружающую среду растения или семени растения) для защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, и от повреждения, вызванного беспозвоночными вредителями.

Для вариантов осуществления, в которых применяют одно или несколько соединений для контроля беспозвоночных вредителей, весовые соотношения этих соединений (всего) к соединениям компонента (а) составляет, как правило, от около 1:3000 до около 3000:1. Следует отметить весовые соотношения от около 1:300 до около 300:1 (например, соотношения от около 1:30 до около 30:1). Специалист в данной области может легко определить посредством несложного проведения исследования биологически эффективные количества активных ингредиентов, необходимых для желательного спектра биологической активности.

Следует отметить композицию настоящего изобретения, которая содержит в дополнение к соединению компонента (а), одного или в комбинации с компонентом (б), по меньшей мере одно соединение или средство для контроля беспозвоночных вредителей, выбранное из группы, состоящей из: абамектина, ацефата, ацетамиприда, ацетопрола, акринатрина, альдикарба, амидофлумета, амитраза, авермектина, азадирахтина, азинфос-метила, бифентрина, бифеназата, бистрифлурона, бупрофезина, карбофурана, картапа, хинометионата, хлорфенапира, хлорфлуазурина,

хлорантранилипрола, хлорпирифоса, хлорпирифос-метила, хлоробензилата, кромафенозида, клотианидина, циантранилипрола, цифлуметофена, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалотрина, гамма-цигалотрина, лямбда-цигалотрина, цигексатина, циперметрина, цирوماзина, дельтаметрина, диафентиурана, диазинона, дикофола,
   
 5 диелдрина, диенохлора, дифлубензурана, димефлутрина, диметоата, динотефурана, диофенолана, эмамектина, эндосульфана, эсфенвалерата, этипрола, этоксазола, фенамифоса, феназаквина, фенбутатина оксида, фенотиокарба, феноксикарба, фенпропатрина, фенпироксимата, фенвалерата, фипронила, флоникамида, флубендиамида, флуцитрината, тау-флювалината, флуфенерима, флуфеноксурона,
   
 10 фонофоса, галофенозида, гексафлумурана, гекситиазокса, гидраметилнона, имициафоса, имидаклоприда, индоксакарба, изофенфоса, люфенурана, малатиона, меперфлутрина, метафлумизона, метальдегида, метамидофоса, метидатиона, метомила, метопрена, метоксихлора, метоксифенозида, метофлутрина, милбемицина оксима, монокротофоса, никотина, нитенпирама, нитиазина, новалурана, новифлумурана, оксамила, паратиона,
   
 15 паратион-метила, перметрина, фората, фозалона, фосмета, фосфамидона, пиримикарба, профенофоса, профлутрина, пропаргита, протрифенбута, пиметрозина, пирафлупрола, пиретрина, пиридабена, пиридалила, пирифлуквиназона, пирипрола, пирипроксифена, ротенона, рианодина, спинеторама, спиносада, спиродиклофена, спиромезифена, спиротетрамата, сульфоксафлора, сульпрофоса, тебуфенозида, тебуфенпирада,
   
 20 тефлубензурана, тефлутрина, тербуфоса, тетрахлорвинфоса, тетраметилфлутрина, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосултап-натрия, толфенпирада, тралометрина, триазамата, трихлорфона, трифлумурана, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, нуклеополиэдровирусов, инкапсулированных дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis*, бакуловирусов, энтомопатогенных бактерий,
   
 25 энтомопатогенных вирусов и энтомопатогенных грибов. Следует отметить вышеописанный список, за исключением меперфлутрина, сульфоксафлора и тетраметилфлутрина.

В определенных случаях комбинации из соединения компонента (а), одного или в смеси с компонентом (b), с иными биологически активными (в частности, для контроля
   
 30 беспозвоночных вредителей) соединениями или средствами (т.е. активными ингредиентами) могут приводить к более чем дополнительному (т.е. синергическому) эффекту. Всегда желательно уменьшение количества активных ингредиентов, высвобождаемых в окружающую среду, и в то же время обеспечение эффективного контроля вредителей. Если возникает синергизм активных ингредиентов для контроля
   
 35 беспозвоночных вредителей при нормах нанесения, дающих сельскохозяйственно удовлетворительные уровни контроля беспозвоночных вредителей, такие комбинации могут быть преимущественными в отношении снижения стоимости получения сельскохозяйственной культуры и уменьшения нагрузки на окружающую среду.

В таблице D1 перечисляются конкретные комбинации средств для контроля
   
 40 беспозвоночных вредителей с соединением 3 (определено в таблице индексов А) в качестве соединения компонента (а), иллюстрирующего смеси и композиции, содержащие эти активные ингредиенты, и способы, в которых их применяют в соответствии с настоящим изобретением. Во второй колонке таблицы D1 перечисляются конкретные средства для контроля беспозвоночных вредителей (например, “Абаментин” в первой
   
 45 строке). В третьей колонке таблицы D1 перечисляются механизм действия (если известен) или химический класс средств для контроля беспозвоночных вредителей. В четвертой колонке таблицы D1 перечисляются варианты осуществления диапазонов весовых соотношений для норм, в которых средство для контроля беспозвоночных вредителей,

как правило, наносится по отношению к соединению 3 отдельно или в комбинации с компонентом (b) (например, “от 50:1 до 1:50” абамектина относительно соединения 3 по весу). Таким образом, например, в первой строке таблицы D1, в частности, раскрывается комбинация соединения 3 с абамектином, как правило, наносимая в весовом соотношении от 50:1 до 1:50. Остальные строки таблицы D1 должны толковаться подобным образом.

Таблица D1				
Компонент (a)	Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Механизм действия или химический класс	Типичное весовое соотношение	
10	соединение 3	абамектин	макроциклические лактоны	от 50:1 до 1:50
	соединение 3	ацетамиприд	неоникотиноиды	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	амитраз	лиганды октопаминовых рецепторов	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	авермектин	макроциклические лактоны	от 50:1 до 1:50
	соединение 3	азадирахтин	агонисты экдизона	от 100:1 до 1:120
15	соединение 3	бета-цифлутрин	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	бифентрин	модуляторы натриевых каналов	от 100:1 до 1:10
	соединение 3	бупрофезин	ингибиторы синтеза хитина	от 500:1 до 1:50
	соединение 3	картап	аналоги неристоксина	от 100:1 до 1:200
	соединение 3	хлорантранилипрол	лиганды рианодиновых рецепторов	от 100:1 до 1:120
	соединение 3	хлорфенапир	ингибиторы митохондриального транспорта электронов	от 300:1 до 1:200
20	соединение 3	хлорпирифос	ингибиторы холинэстеразы	от 500:1 до 1:200
	соединение 3	клотианидин	неоникотиноиды	от 100:1 до 1:400
	соединение 3	циантранилипрол	лиганды рианодиновых рецепторов	от 100:1 до 1:120
	соединение 3	цифлутрин	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	цигалотрин	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	циперметрин	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
25	соединение 3	циромазин	ингибиторы синтеза хитина	от 400:1 до 1:50
	соединение 3	дельтаметрин	модуляторы натриевых каналов	от 50:1 до 1:400
	соединение 3	диелдрин	циклодиеновые инсектициды	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	динотефуран	неоникотиноиды	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	диофенолан	ингибитор линьки	от 150:1 до 1:200
30	соединение 3	эмаектин	макроциклические лактоны	от 50:1 до 1:10
	соединение 3	эндосульфат	циклодиеновые инсектициды	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	эсфенвалерат	модуляторы натриевых каналов	от 100:1 до 1:400
	соединение 3	этипрол	блокаторы GABA-регулируемых хлоридных каналов	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	фенотиокарб		от 150:1 до 1:200
35	соединение 3	феноксикарб	имитаторы ювелирного гормона	от 500:1 до 1:100
	соединение 3	фенвалерат	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	фипронил	блокаторы GABA-регулируемых хлоридных каналов	от 150:1 до 1:100
	соединение 3	флоникамид		от 200:1 до 1:100
	соединение 3	флубендиамид	лиганды рианодиновых рецепторов	от 100:1 до 1:120
	соединение 3	флуфеноксурон	ингибиторы синтеза хитина	от 200:1 до 1:100
40	соединение 3	гексафлумурон	ингибиторы синтеза хитина	от 300:1 до 1:50
	соединение 3	гидраметилнон	ингибиторы митохондриального транспорта электронов	от 150:1 до 1:250
	соединение 3	имidakлоприд	неоникотиноиды	от 1000:1 до 1:1000
	соединение 3	индоксакарб	модуляторы натриевых каналов	от 200:1 до 1:50
45	соединение 3	лямбда-цигалотрин	модуляторы натриевых каналов	от 50:1 до 1:250
	соединение 3	люфенурон	ингибиторы синтеза хитина	от 500:1 до 1:250
	соединение 3	меперфлутрин	модуляторы натриевых каналов	от 100:1 до 1:400
	соединение 3	метафлумизон		от 200:1 до 1:200
	соединение 3	метомил	ингибиторы холинэстеразы	от 500:1 до 1:100
	соединение 3	метопрен	имитаторы ювелирного гормона	от 500:1 до 1:100

5	соединение 3	метоксифенозид	агонисты экдизона	от 50:1 до 1:50
	соединение 3	нитенпирам	неоникотиноиды	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	нитиазин	неоникотиноиды	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	новалурон	ингибиторы синтеза хитина	от 500:1 до 1:150
	соединение 3	оксамил	ингибиторы холинэстеразы	от 200:1 до 1:200
	соединение 3	пиметрозин		от 200:1 до 1:100
	соединение 3	пиретрин	модуляторы натриевых каналов	от 100:1 до 1:10
	соединение 3	пиридабен	ингибиторы митохондриального транспорта электронов	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	пиридалил		от 200:1 до 1:100
10	соединение 3	пирипроксифен	имитаторы ювенильного гормона	от 500:1 до 1:100
	соединение 3	рианодин	лиганды рианодиновых рецепторов	от 100:1 до 1:120
	соединение 3	спинеторам	макроциклические лактоны	от 150:1 до 1:100
	соединение 3	спиносад	макроциклические лактоны	от 500:1 до 1:10
	соединение 3	спиродиклофен	ингибиторы биосинтеза липидов	от 200:1 до 1:200
	соединение 3	спиромезифен	ингибиторы биосинтеза липидов	от 200:1 до 1:200
15	соединение 3	сульфосафлор		от 200:1 до 1:200
	соединение 3	тебуфенозид	агонисты экдизона	от 500:1 до 1:250
	соединение 3	тетраметилфлутрин	модуляторы натриевых каналов	от 100:1 до 1:40
	соединение 3	тиаклоприд	неоникотиноиды	от 100:1 до 1:200
	соединение 3	тиаметоксам	неоникотиноиды	от 1250:1 до 1:1000
	соединение 3	тиодикарб	ингибиторы холинэстеразы	от 500:1 до 1:400
20	соединение 3	тиосултап-натрий		от 150:1 до 1:100
	соединение 3	тралометрин	модуляторы натриевых каналов	от 150:1 до 1:200
	соединение 3	триазамат	ингибиторы холинэстеразы	от 250:1 до 1:100
	соединение 3	трифлумурон	ингибиторы синтеза хитина	от 200:1 до 1:100
	соединение 3	Bacillus thuringiensis	биологические средства	от 50:1 до 1:10
25	соединение 3	дельта-эндоксин thuringiensis Bacillus	биологические средства	от 50:1 до 1:10
	соединение 3	NPV (например, Gemstar)	биологические средства	от 50:1 до 1:10

Каждая из таблиц D2-D43 устроена так же, как таблица D1 выше, за исключением того, что записи под заголовком колонки “Компонент (а)” заменяются соответствующей записью колонки компонента (а), показанной ниже. Таким образом, например, в таблице D2 все записи под заголовком колонки “Компонент (а)” повторяет “соединение 7”, и в первой строке под заголовками колонок в таблице D2, в частности, раскрывается смесь соединения 7 с абамектином. Таблицы D3-D43 устроены подобным образом.

Номер таблицы	Запись колонки компонента (а)	Номер таблицы	Запись колонки компонента (а)	
35	D2	соединение 7	D23	соединение 252
	D3	соединение 8	D24	соединение 253
	D4	соединение 13	D25	соединение 254
	D5	соединение 17	D26	соединение 257
	D6	соединение 40	D27	соединение 258
	D7	соединение 47	D28	соединение 259
	D8	соединение 81	D29	соединение 260
40	D9	соединение 82	D30	соединение 261
	D10	соединение 122	D31	соединение 262
	D11	соединение 136	D32	соединение 263
	D12	соединение 143	D33	соединение 264
	D13	соединение 144	D34	соединение 265
	D14	соединение 161	D35	соединение 266
45	D15	соединение 195	D36	соединение 267
	D16	соединение 238	D37	соединение 268
	D17	соединение 239	D38	соединение 269
	D18	соединение 240	D39	соединение 270
	D19	соединение 241	D40	соединение 271

D20	соединение 244	D41	соединение 273
D21	соединение 245	D42	соединение 275
D22	соединение 247	D43	соединение 276

Один вариант осуществления средств для контроля беспозвоночных вредителей (например, инсектицидов и акарицидов) для смешивания с соединениями компонента (а) включает модуляторы натриевых каналов, такие как бифентрин, циперметрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, дельтаметрин, димефлутрин, эсфенвалерат, фенвалерат, индоксакарб, меперфлутрин, метофлутрин, профлутрин, пиретрин, тетраметилфлутрин и тралометрин; ингибиторы холинэстеразы, такие как хлорпирифос, метомил, оксамил, тиодикарб и триазамат; неоникотиноиды, такие как ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд и тиаметоксам; инсектицидные макроциклические лактоны, такие как спинеторам, спиносад, абамектин, авермектин и эмаектин; блокаторы GABA ( $\gamma$ -аминомасляная кислота)-регулируемых хлоридных каналов, такие как эндосульфат, этипрол и фипронил; ингибиторы синтеза хитина, такие как бупрофезин, циромазин, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, новифлумурон и трифлумурон; имитаторы ювельнильного гормона, такие как диофенолан, феноксикарб, метопрен и пирипроксифен; лиганды октопаминовых рецепторов, такие как амитраз; агонисты экдизона, такие как азадирахтин, метоксифенозид и тебуфенозид; лиганды рианодиновых рецепторов, такие как рианодин, аминокислотные диамины, такие как хлорантранилипрол, циантранилипрол и флубендиамид; аналоги нерестиноксина, такие как картап; ингибиторы митохондриального транспорта электронов, такие как хлорфенапир, гидраметилнон и пиридабен; ингибиторы биосинтеза липидов, такие как спироциклофен и спирумезифен; циклодиеновые инсектициды, такие как диелдрин; цифлуметофен; фенотиокарб; флониамид; метафлумизон; пирафлупрол; пиридалил; пирипрол; пиметрозин; спиротетрамат и тиосултап-натрий. Один вариант осуществления биологических средств для смешивания с соединениями компонента (а) включает нуклеополиэдровирус, такой как HzNPV и AfNPV; *Bacillus thuringiensis* и инкапсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, такие как Cellcap, MPV и MPVII; а также встречающиеся в природе и генетически модифицированные вирусные инсектициды, в том числе члены семейства *Baculoviridae*, а также энтомофильные грибы. Следует отметить композицию, содержащую компонент (а) и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство, выбранное из средств для контроля беспозвоночных вредителей, перечисленных в таблице D1 выше.

Композиции настоящего изобретения применимы в качестве средств для контроля болезней растений. Настоящее изобретение, следовательно, дополнительно включает способ контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами растений, включающий нанесение на растение или его часть, подлежащие защите, или на семя растения или единицу вегетативного размножения, подлежащие защите, эффективного количества композиции настоящего изобретения (например, композиции, содержащей компонент (а) или компоненты (а) и (б)). Этот аспект настоящего изобретения можно также описать как способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий нанесение фунгицидно эффективного количества композиции настоящего изобретения на растение (или его часть) или семя растения (непосредственно или посредством окружающей среды (например, среды для выращивания) растения или семени растения).

Контроль болезней растений обычно сопровождается нанесением эффективного количества композиции настоящего изобретения (например, содержащей компонент

(а) или смесь из компонентов (а) и (b)), как правило, в виде составленной композиции либо до, либо после заражения, на часть растения, подлежащую защите, такую как корни, стебли, листва, плоды, семена, клубни или луковицы, или в среду (почву или песок), в которой выращиваются растения, подлежащие защите. Компонент (а) или его смеси также можно наносить на семена для защиты семян и сеянцев, развивающихся из семян. Для обработки растений смеси также можно наносить через поливную воду.

На подходящие нормы нанесения (например, фунгицидно эффективные количества) компонента (а) (т.е. по меньшей мере одного соединения, выбранного из соединений формулы 1, их N-оксидов и солей), а также подходящие нормы нанесения (например, биологически эффективные количества, фунгицидно эффективные количества или инсектицидно эффективные количества) для смесей и композиций, содержащих компонент (а) по настоящему изобретению, могут влиять многие факторы окружающей среды, и их следует определять при текущих условиях применения. Листву обычно можно защитить при норме обработки от около менее 1 г/га до около 5000 г/га активных ингредиентов. Семя и сеянцы обычно можно защитить при норме обработки семян от около 0,1 до около 10 г на килограмм семян; и единицы вегетативного размножения (например, отводки и клубни) обычно можно защитить при норме обработки единицы размножения от около 0,1 до около 10 г на килограмм единицы размножения. Специалист в данной области может легко определить посредством несложного проведения исследования нормы нанесения компонента (а), его смесей и композиций, содержащих конкретные комбинации активных ингредиентов по настоящему изобретению, необходимые для обеспечения желательного спектра защиты растений, контроля болезней растений и необязательно других вредителей растений.

Соединения формулы 1, их N-оксиды и соли являются особо эффективными для контроля болезней растений, вызванных патогенными грибами, в частности классов базидомицет и аскомицет. Объединяя эти соединения с другими фунгицидными соединениями, можно обеспечивать контроль болезней, вызванных широким спектром патогенных грибов растений классов базидомицет, аскомицет, оомицет и дейтеромицет. В соответствии с этим, с помощью смесей и композиций, описанных в данном документе, можно контролировать широкий спектр болезней растений, патогенов листьев сельскохозяйственных культур, в том числе: зерновых злаковых сельскохозяйственных культур, таких как пшеница, ячмень, овес, рожь, тритикале, рис, маис, сорго и просо; лозных сельскохозяйственных культур, таких как столовые и винные сорта винограда; полевых сельскохозяйственных культур, таких как масличный рапс (канола), подсолнечник; сахарная свекла, сахарный тростник, соя, арахис (земляной орех), табак, люцерна, клевер, леспедеца, трилистник и вика; семечковых плодовых, таких как яблоня, груша, дикая яблоня, локва, боярышник и айва; косточковых плодовых, таких как персики, вишни, сливы, абрикосы, нектарины и миндаль; цитрусовых плодовых, таких как лимоны, лайм, апельсины, грейпфрут, мандарин (танжерин) и кумкват; корневых и клубневых овощных культур и полевых сельскохозяйственных культур (и их листья), таких как артишок, столовая и сахарная свекла, морковь, кассава, имбирь, женьшень, хрен, пастернак, картофель, редька, брюква, батат, репа и ямс; луковичных овощных культур, таких как чеснок, лук-порей, лук и лук-шалот; зеленных овощных культур, таких как руккола (эрука), сельдерей, кресс-салат, эндивий (эскарриоль), фенхель, кочанный и листовой салат, петрушка, радиккио (красный цикорий), ревен, шпинат и листовая свекла; капустных (кочанных) листовых овощных культур, таких как брокколи, капуста полевая (сурепица), брюссельская капуста, капуста огородная, капуста китайская, цветная капуста, браунколь, капуста кормовая, кольраби, горчица

и зелень; бобовых овощных культур (сочных или высушенных), таких как люпин, фасоль (*Phaseolus* spp.) (в том числе кормовые бобы, фасоль обыкновенная, фасоль лимская, турецкие бобы, фасоль пинто, фасоль многоцветковая, луцильные сорта фасоли, тепари и восковая фасоль), бобы (*Vigna* spp.) (в том числе адзуки, вигна, долихос круглосемянный, голубиный горох, китайские длинные бобы, лагута, вигна початковая, мотт, маш, рисовый боб, вигна китайская, боб урид и коровий горох), конские бобы (фава), нут (бараний горох), хьюар, канавалия мечевидная, лаблаб, чечевица и горох (*Pisum* spp.) (в том числе горох низкий, горох огородный сахарный, горох английский, горох полевой, горох огородный, горох посевной, горох в стручках, горох сахарный, каянус и соя); плодовых овощей, таких как баклажан, физалис (*Physalis* spp.), пегино и перец (в том числе перец салатный, перец острый, перец столовый, перец душистый, перец сладкий); мексиканский томат и помидор; тыквенных овощных культур, таких как чайот (плоды), китайская восковая тыква (зимняя дыня), арбуз кормовой, огурец, ангурия, съедобная бутылочная тыква (в том числе лагенария, кукуцца, люффа и люффа остроробристая), *Momordica* spp. (в том числе момордика бальзамическая, момордика харанция, горькая дыня и китайский огурец), дыня мускусная (в том числе канталупа и тыква), тыква обыкновенная и тыква крупноплодная (в том числе тыква мускатная, тыква кормовая, тыква гигантская, желудевая тыква, тыква-спагетти) и арбуз; ягод, таких как ежевика (в том числе бинглберри (*bingleberry*), бойзенова ягода, ежевика сизая, лоуберри (*lowberry*), марионберри (*marionberry*), олаллиберри (*olallieberry*) и янгберри (*youngberry*)), голубика, клюква, смородина, бузина, крыжовник, черника, логанова ягода, малина и земляника; орехоплодных деревьев, таких как миндаль, буковый орешек, американский орех, орех серый, анакардия западная, каштан съедобный, каштан карликовый, лещина (фундук), орех гикори, орех макадамия, кария пекан и грецкий орех; тропических плодовых и других сельскохозяйственных культур, таких как бананы, бананы съедобные, манго, кокосы, папайя, гуайява, авокадо, личи, агава, кофейное дерево, дерево какао, сахарный тростник, масличная пальма, кунжут, гевея и пряности; волокнистых сельскохозяйственных культур, таких как хлопчатник, лен и конопля; газонных трав (в том числе газонных трав для теплого и холодного сезона), таких как полевица, мятлик луговой, августинова трава, овсяница тростниковая и бермудская трава.

Эти патогены включают: оомицеты, в том числе патогены *Phytophthora*, такие как *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* и *Phytophthora capsici*, патогены *Pythium*, такие как *Pythium aphanidermatum*, и патогены семейства *Peronosporaceae*, такие как *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (в том числе *Peronospora tabacina* и *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (в том числе *Pseudoperonospora cubensis*) и *Bremia lactucae*; аскомицеты, в том числе патогены *Alternaria*, такие как *Alternaria solani* и *Alternaria brassicae*, патогены *Guignardia*, такие как *Guignardia bidwelli*, патогены *Venturia*, такие как *Venturia inaequalis*, патогены *Septoria*, такие как *Septoria nodorum* и *Septoria tritici*, патогены настоящей мучнистой росы, такие как *Blumeria* spp. (в том числе *Blumeria graminis*) и *Erysiphe* spp. (в том числе *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea* и *Podospaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, патогены *Botrytis*, такие как *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, патогены *Sclerotinia*, такие как *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, патогены *Helminthosporium*, такие как *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, патогены антракноза, такие как *Glomerella* или *Colletotrichum* spp. (такие как *Colletotrichum graminicola* и *Colletotrichum orbiculare*) и *Gaeumannomyces graminis*; базидиомицеты, в том числе ржавчины, вызванные *Puccinia* spp. (такими как *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*,

Puccinia hordei, Puccinia graminis и Puccinia arachidis), Hemileia vastatrix и Phakopsora pachyrhizi; иные патогены, в том числе Rhizoctonia spp. (такие как Rhizoctonia solani и Rhizoctonia oryzae); патогены Fusarium, такие как Fusarium roseum, Fusarium gramineum и Fusarium oxysporum; Verticillium dahliae; Sclerotium rolfsii; Rynchosporium secalis; Cercosporidium personatum, Cercospora arachidicola и Cercospora beticola; Rutstroemia floccosum (также известный как Sclerontina homoeocarpa); и другие роды и виды, близкородственные с этими патогенами. Обычно патогены рассматривают как болезни, и таким образом в предыдущем предложении слово “патоген” также относится к болезни растения, вызванной патогеном. Точнее, болезни растений вызываются патогенами.

Следовательно, например, настоящая мучнистая роса представляет собой болезни растений, вызванные патогенами настоящей мучнистой росы, болезни, вызываемые Septorias, представляют собой болезни растений, вызванные патогенами Septoria, и ржавчины представляют собой болезни растений, вызванные патогенами ржавчины. Определенные фунгицидные соединения также являются бактерицидными и, следовательно, в дополнение к их фунгицидной активности, композиции или комбинации могут также обладать активностью в отношении бактерий, таких как Erwinia amylovora, Xanthomonas campestris, Pseudomonas syringae и других родственных видов.

Примечательно, что 2,6-замещенные анилин-пиразольные соединения формулы 1 (т.е. формулы 1, где X представляет собой NH, а  $R^1$  и  $R^3$  иные, чем H), где  $R^2$  представляет собой H, как было выяснено в ходе данной работы, имеют значительно улучшенные фармакокинетические свойства по сравнению с соответствующими соединениями, где  $R^2$  является иным, чем H. В частности, было обнаружено, что у позвоночных животных соединения, где  $R^2$  представляет собой H вместо иных, чем H, имеют значительно уменьшенное распределение в жире, тем самым снижая возможность биоаккумуляции. Иллюстративными 2,6-замещенными анилин-пиразольными соединениями формулы 1, где  $R^2$  представляет собой H, являются соединения 239, 240, 241, 244, 245, 247, 252, 253, 254, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 273, 275 и 276, установленные в таблице индексов А. Кроме того было выяснено, что в дополнение к обладанию более положительными фармакокинетическими свойствами у позвоночных животных 2,6-замещенные анилин-пиразольные соединения формулы 1, где  $R^1$  представляет собой галоген, или конкретнее Cl или Br, и  $R^3$  представляет собой F или Cl, или конкретнее F, сохраняют заметно высокую активность, когда  $R^2$  представляет собой H, в отношении грибковых болезней растений, таких как вызванных Septoria tritici.

Фармакокинетические свойства соединений формулы 1 можно измерять с применением большого разнообразия протоколов анализов, известных в науке фармакологии. В одном иллюстративном способе, предполагающем однократную пероральную дозу, три самца и три самки крыс получали однократную дозу тестируемого вещества путем перорального зондового питания. Приблизительно 0,25 мл крови собирается через хвостовую вену непосредственно перед введением дозы, и затем в 0,25, 0,5, 1, 2, 4, 8, 12, 24 часа и каждые 24 часа в дальнейшем до умерщвления. При умерщвлении также собирают жир, чтобы определить соотношение жир:плазма до умерщвления. Кровь собирают в пробирки, которые содержат этилендиаминтетрауксусную кислоту (EDTA), и центрифугируют при 2500 x g, чтобы отделить плазму от кровяных клеток. Затем плазму экстрагируют посредством осаждения белков с применением, например, ацетонитрила и планшета для осаждения

белков (например, Strata Impact Protein Precipitation Plate, номер в каталоге CEO-7565 Phenomenex, Torrance, CA, США), следуя указаниям, предусмотренным для планшета. В качестве альтернативы, плазму экстрагируют только ацетонитрилом, интенсивно перемешивают (т.е. перемешивают с применением вихревой мешалки) и центрифугируют до осаждения белков. После удаления белков плазму анализируют касательно основного соединения и/или метаболитов с помощью жидкостной хроматографии-масс-спектрометрии (LC/MS). Жир гомогенизируют и экстрагируют с помощью органического растворителя, такого как ацетонитрил. Затем экстракт анализируют касательно основного соединения и/или метаболитов с помощью LC/MS. Затем фармакокинетические данные плазмы анализируют с применением программного обеспечения для нелинейного моделирования (например, WinNonlin™ от Pharsight, Cary, NC, США) для определения периода полужизни введенного соединения в плазме, времени после введения, когда достигается максимальная концентрация в плазме (Tmax), максимальной концентрации в плазме (Cmax) и площади под кривой плазменной концентрации (AUC). Поскольку анализ жира требует умерщвления крыс, данные для жира получают для одного момента времени (т.е. времени умерщвления крысы). Однако, используя несколько крыс, умерщвленных после различных интервалов от времени дозирования, определяют такие параметры, как Cmax, для жира. Применяя описанный выше способ, обнаружено, что соединения 239, 240 и 241, указанные в таблице индексов А, обладают значительно уменьшенным распределением в жире по сравнению с соответствующими соединениями, где  $R^2$  является иным, чем Н.

В настоящих фунгицидных композициях соединения формулы 1 компонента (а) могут работать синергично с дополнительными фунгицидными соединениями компонента (b) для обеспечения таких положительных результатов, как расширение спектра контролируемых болезней растений, увеличение продолжительности профилактической и лечебной защиты и подавление размножения резистентных патогенных грибов. В конкретных вариантах осуществления обеспечиваются композиции в соответствии с настоящим изобретением, которые содержат доли компонента (а) и компонента (b), что особенно применимы для контроля конкретных грибковых болезней (таких как *Alternaria solani*, *Blumeria graminis* f. sp. *tritici*, *Botrytis cinerea*, *Puccinia recondita* f. sp. *tritici*, *Rhizoctonia solani*, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*).

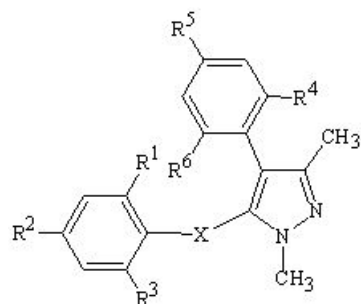
Смеси фунгицидов также могут обеспечивать значительно лучший контроль болезней, нежели можно было предсказать на основе активности отдельных компонентов. Этот синергизм был описан как “совместное действие двух компонентов смеси, так что общий эффект являлся большим или более продолжительным, чем сумма эффектов двух (или более), взятых независимо” (см., Р. М. L. Tames, *Neth. J. Plant Pathology* 1964, 70, 73-80). В способах, обеспечивающих контроль болезней растений, в которых эффект синергии проявляется от комбинации активных ингредиентов (например, фунгицидных соединений), нанесенных на растение или семя, активные ингредиенты наносят в синергическом весовом соотношении и синергических (т.е. синергически эффективных) количествах. Показатели контроля болезней, ингибирования и профилактики не могут превышать 100%. Следовательно выражение существенного синергизма, как правило, требует применения норм нанесения активных ингредиентов, при которых активные ингредиенты по-отдельности обеспечивают намного меньше 100% эффекта, так что их суммарный эффект существенно меньше 100%, что дает возможность увеличения эффекта в результате синергизма. С другой стороны, нормы нанесения активных ингредиентов, которые являются слишком низкими, могут не показывать большой активности в смесях даже с преимуществом синергизма. Специалист в данной области

посредством несложного проведения исследования может легко выяснить и оптимизировать весовые соотношения и нормы нанесения (т.е. количества) фунгицидных соединений, обеспечивающих эффект синергии.

Следующие тесты включают тесты, демонстрирующие эффективность настоящих соединений в отношении контроля конкретных патогенов; таким образом, эта эффективность обеспечивается для фунгицидных смесей, содержащих настоящие соединения. Следующие тесты также включают тесты, демонстрирующие эффективность контроля смесей настоящего изобретения относительно конкретных патогенов. Однако, контроль болезней, предоставляемый настоящими соединениями отдельно или в смесях, не ограничивается видами патогенных грибов, приведенных в качестве примера.

См. таблицу индексов А для описания соединений. См. таблицу индексов В для данных точки плавления. См. таблицу индексов С для данных  $^1\text{H}$  ЯМР. В таблицах-указателях применяются следующие сокращения: Me представляет собой метил, MeO представляет собой метокси, EtO представляет собой этокси и CN представляет собой циано. Ввиду симметрии  $R^1$  может взаимозаменяться  $R^3$ , а  $R^4$  может взаимозаменяться  $R^6$ , если это позволяют определения  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  и  $R^6$ . Сокращение “соед.” обозначает “соединение”, а сокращение “пр.” обозначает “пример”, за которым следует номер, указывающий на то, в каком примере синтеза соединение получено. Массовые спектры (MS) сообщаются в виде молекулярного веса исходного иона с самым высоким относительным содержанием изотопа (M+1), образованного добавлением  $\text{H}^+$  (молекулярный вес 1) к молекуле, что наблюдали посредством масс-спектрометрии с применением химической ионизации при атмосферном давлении ( $\text{AP}^+$ ). О присутствии молекулярных ионов, включающих один или несколько изотопов с более высоким атомным весом более низкой встречаемости (например,  $^{37}\text{Cl}$ ,  $^{81}\text{Br}$ ), не сообщается.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ А



№ соед.	$R^1$	$R^2$	$R^3$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	M.S.
1	F	H	H	Cl	F	H	NH	334
2	F	F	H	Cl	F	H	NH	352
3 (Пр. 1)	F	MeO	F	Cl	F	H	NH	**
4	F	F	F	Cl	F	H	NH	370
5	F	MeO	H	Cl	F	H	O	365
6	F	F	H	F	MeO	F	NH	366
7 (Пр. 2)	F	F	F	F	MeO	F	NH	**
8 (Пр. 6)	F	-CN	F	F	F	F	O	**
9	Cl	Cl	H	F	F	F	O	387
10	Cl	Cl	H	F	MeO	F	O	399
11	F	F	F	F	F	H	NH	354
12	F	MeO	F	F	F	H	NH	366
13 (Пр. 3)	F	-CN	F	Cl	F	H	O	**
14	F	-CN	F	F	MeO	H	O	374

	15	F	Cl	F	F	MeO	F	O	***
	16	F	MeO	F	Cl	Cl	H	NH	398
	17 (Пр. 4)	F	F	H	Cl	Cl	H	NH	**
5	18	F	F	F	Cl	Cl	H	NH	386
	19	F	MeO	F	F	F	F	NH	384
	20	F	-CN	F	F	MeO	F	NH	391
	21	F	MeO	F	F	MeO	F	NH	396
	22	F	H	F	F	MeO	F	O	367
	23	Cl	F	H	F	MeO	F	NH	382
	24	F	Br	F	F	MeO	F	O	447
10	25	F	-CN	F	Cl	F	H	NH	377
	26	F	-CN	F	F	F	F	NH	379
	27	F	-CN	H	F	F	F	O	362
	28	Cl	-CN	H	F	F	F	O	378
	29	F	F	F	Cl	MeO	H	NH	382
	30	F	F	H	F	-CN	F	NH	361
15	31	Cl	F	H	F	-CN	F	NH	*
	32	Cl	-CN	H	F	MeO	F	NH	389
	33	F	-CN	H	Cl	F	H	O	360
	34	F	-CN	H	F	F	F	NH	361
	35	F	F	F	F	-CN	F	NH	*
	36	F	MeO	F	F	-CN	F	NH	*
20	37	Cl	-CN	H	Cl	F	H	O	376
	38	F	-CN	F	F	MeO	F	O	392
	39	F	F	H	F	EtO	F	NH	380
	40	F	Cl	H	F	-CN	F	NH	*
	41	F	-CN	F	Cl	MeO	H	O	390
25	42	F	F	H	Cl	MeO	H	NH	364
	43	F	H	F	Cl	MeO	H	NH	364
	44	Cl	-CN	H	Cl	F	H	NH	375
	45	F	-CN	F	F	F	H	O	362
	46	F	H	F	Cl	F	H	NH	352
	47	Cl	F	H	Cl	F	H	NH	368
30	48	F	F	H	Cl	H	F	NH	352
	49	F	F	H	F	H	F	NH	*
	50	Cl	Cl	H	F	H	F	NH	*
	51	F	MeO	H	F	H	F	NH	*
	52	F	F	H	F	H	H	NH	318
	53	F	F	F	F	H	H	NH	336
35	54	F	MeO	F	F	H	H	NH	348
	55	F	MeO	F	Cl	H	F	NH	382
	56	F	F	F	Cl	H	F	NH	369
	57	F	-CN	F	Cl	H	F	NH	377
	58	Cl	F	H	Cl	H	F	NH	368
	59	F	-CN	H	F	H	F	NH	343
40	60	Cl	MeO	H	F	H	F	NH	*
	61	Cl	F	H	F	F	H	NH	*
	62	F	F	H	F	MeO	F	CHOH	381
	63	F	MeO	H	F	F	H	NH	*
	64	F	F	H	F	F	H	NH	336
	65	F	-CN	F	Br	F	H	O	423
45	66	Cl	MeO	H	F	F	H	NH	*
	67	Cl	Cl	H	F	F	H	NH	*
	68	F	-CN	H	F	F	H	NH	*
	69	F	H	F	F	H	F	NH	*
	70	F	F	F	Br	H	H	NH	398

	71	F	H	F	F	F	H	NH	*
	72	F	MeO	F	F	H	F	NH	*
	73	Br	F	H	Cl	F	H	NH	413
	74	F	F	F	Br	F	H	NH	415
5	75	F	-CN	F	Cl	H	H	O	*
	76	F	-CN	F	Br	H	H	O	*
	77	Cl	Cl	H	Cl	MeO	H	NH	397
	78	Cl	Cl	H	Cl	H	F	NH	386
	79	F	-CN	H	Br	F	H	O	406
	80	Cl	-CN	H	Br	F	H	O	422
10	81	F	Cl	F	Cl	F	H	NH	386
	82	Cl	F	F	Cl	F	H	NH	386
	83	F	-CN	F	F	F	H	NH	*
	84	Cl	F	F	Br	F	H	NH	431
	85	Cl	MeO	Cl	Cl	F	H	NH	413
	86	Cl	F	F	F	H	F	NH	370
15	87	Cl	F	F	Cl	H	F	NH	386
	88	Cl	Cl	H	Cl	F	H	NH	383
	89	F	F	F	F	H	F	NH	*
	90	F	-CN	F	F	H	F	NH	*
	91	F	-CN	F	F	H	H	O	*
	92	F	-CN	H	Cl	MeO	H	O	372
	93	Cl	-CN	H	Cl	MeO	H	O	388
20	94	F	F	H	Br	F	H	NH	398
	95	Br	F	H	Br	F	H	NH	458
	96	Cl	F	H	Br	F	H	NH	414
	97	F	F	H	Cl	H	H	NH	334
	98	Cl	F	Cl	Br	F	H	NH	448
25	99	Cl	-CN	H	Br	MeO	H	O	433
	100	F	-CN	H	Br	MeO	H	O	418
	101	Cl	MeO	H	Cl	F	H	NH	380
	102	Cl	MeO	Cl	Br	F	H	NH	459
	103	Cl	MeO	H	Br	F	H	NH	425
	104	Cl	EtO	H	Cl	F	H	NH	394
30	105	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	NH	*
	106	F	-CN	F	Cl	F	F	NH	395
	107	F	F	H	Cl	-CN	H	NH	359
	108	Cl	F	F	Cl	-CN	H	NH	393
	109	Cl	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
	110	F	H	F	Cl	-CN	H	NH	359
35	111	F	Cl	F	Cl	-CN	H	NH	393
	112	Cl	F	H	Cl	-CN	H	NH	375
	113	F	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
	114	Br	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
	115	Cl	F	Cl	Cl	H	Cl	NH	*
40	116	F	-CN	H	Cl	H	F	O	360
	117	Cl	F	F	F	F	H	NH	369
	118	Br	F	H	F	F	H	NH	398
	119	F	-CN	H	F	Cl	H	O	360
	120	Br	F	Cl	F	F	H	NH	432
	121	F	Cl	F	F	H	F	NH	370
45	122 (Пп. 5)	F	F	H	Cl	F	H	CHOH	**
	123	Cl	F	H	Cl	F	H	CHOH	383
	124	F	H	F	Cl	Cl	H	NH	*
	125	Cl	F	H	Cl	Cl	H	NH	*
	126	F	Cl	F	F	F	H	NH	370
	127	Cl	-CN	H	F	H	F	O	360

RU 2 572 202 C2

	128	F	-CN	H	F	F	H	O	376
	129	F	Cl	F	Br	F	H	NH	432
	130	F	-CN	H	F	H	F	O	344
	131	Cl	-CN	H	Cl	Cl	H	O	394
5	132	Cl	F	Cl	Cl	Cl	H	NH	*
	133	F	Br	F	F	F	H	NH	416
	134	F	Br	F	Cl	F	H	NH	432
	135	F	Br	H	Cl	F	H	NH	414
	136	Cl	Cl	F	Cl	F	H	NH	402
10	137	Cl	F	Cl	F	F	H	NH	386
	138	Cl	F	Cl	Cl	F	H	NH	404
	139	Br	-CN	H	F	F	H	O	406
	140	Cl	-CN	H	F	F	H	O	360
	141	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
	142	Cl	F	Cl	F	H	F	NH	386
15	143	Br	F	F	F	F	H	NH	416
	144	Br	F	F	Cl	F	H	NH	432
	145	F	Br	F	F	H	F	NH	416
	146	Br	F	F	F	H	F	NH	416
	147	Br	F	F	Cl	H	F	NH	
	148	F	Cl	F	Cl	F	H	CHOH	401 ‡
20	150	F	Cl	F	F	-CN	H	NH	377
	151	Cl	F	F	Cl	F	H	CHOH	
	152	Br	F	H	F	F	H	CHOH	
	153	Br	F	H	Cl	F	H	CHOH	427 †
	154	F	Br	H	F	F	H	NH	396
	155	Cl	Br	Cl	F	F	H	NH	448
25	156	Cl	F	F	Cl	Cl	H	NH	*
	157	F	Cl	F	Cl	Cl	H	NH	*
	158	F	Cl	H	Cl	F	H	O	369
	159	F	-CN	H	F	F	H	O	344
	160	F	Cl	H	F	F	H	NH	352
	161	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
30	162	F	Cl	H	F	H	F	NH	352
	163	F	Br	F	Br	F	H	NH	474
	164	Cl	Br	Cl	Cl	F	H	NH	464
	165	Cl	Cl	Cl	F	F	H	NH	404
	167	Cl	Br	H	F	F	H	NH	414
35	168	Cl	Br	Cl	Br	F	H	NH	508
	169	F	Br	H	Br	F	H	NH	458
	170	Cl	Cl	Cl	Cl	F	H	NH	420
	172	Cl	Br	H	Cl	F	H	NH	430
	173	Cl	Br	H	Br	F	H	NH	474
	174	Cl	Cl	Cl	Br	F	H	NH	464
40	175	I	F	H	F	F	H	NH	444
	177	F	Cl	H	Cl	F	H	CHOH	384
	178	F	F	F	Cl	F	H	CHOH	385
	179	F	-CN	H	Cl	F	H	CHOH	374
	180	F	Cl	I	F	F	H	NH	478
	181	I	F	H	Cl	F	H	NH	460
45	182	F	Cl	I	Cl	F	H	NH	494
	183	Br	Br	H	Cl	F	H	NH	474
	184	Br	Br	H	F	F	H	NH	458
	185	F	Cl	F	F	MeO	H	NH	382
	186	F	Cl	Br	Cl	F	H	NH	448
	187	F	F	Cl	F	MeO	H	NH	396

RU 2 572 202 C2

	188	F	F	Cl	F	EtO	H	NH	396
	189	F	Cl	F	F	EtO	H	NH	396
	190	F	Cl	Cl	F	EtO	H	NH	412
	191	F	Cl	Cl	F	MeO	H	NH	398
5	192	Cl	F	Cl	F	EtO	H	NH	412
	193	F	F	H	F	EtO	H	NH	***
	194	Cl	F	Cl	F	MeO	H	NH	398
	195	Br	F	F	Br	F	H	NH	476
	196	F	F	Cl	F	EtO	F	NH	414
10	197	Cl	Cl	I	Cl	F	H	NH	512
	198	Cl	Cl	F	F	EtO	F	NH	430
	199	F	Cl	F	F	EtO	F	NH	414
	200	Cl	F	Cl	F	EtO	F	NH	430
	201	F	Cl	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
	202	F	Cl	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
15	203	F	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	398
	204	F	Cl	F	Cl	MeO	H	NH	398
	205	Cl	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
	206	F	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	412
	207	F	Cl	F	Cl	EtO	H	NH	412
	208	Cl	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
20	209	F	F	H	Cl	EtO	H	NH	378
	210	Cl	Cl	I	F	F	H	NH	494
	211	Br	Br	F	F	F	H	NH	476
	212	Br	Br	F	Cl	F	H	NH	492
	213	F	F	I	Cl	F	H	NH	478
	214	F	F	I	F	F	H	NH	462
25	215	F	F	I	Br	F	H	NH	524
	216	F	I	F	F	F	H	NH	462
	217	F	I	F	Cl	F	H	NH	478
	218	F	I	F	Br	F	H	NH	524
	219	I	F	F	Cl	MeO	H	NH	490
	220	F	I	F	Cl	MeO	H	NH	490
30	221	F	F	Br	Cl	MeO	H	NH	444
	222	Cl	Cl	F	I	F	H	NH	494
	223	Br	Br	F	I	F	H	NH	584
	224	F	Cl	F	Cl	MeO	H	CHOH	413
	225	F	Cl	F	I	F	H	NH	478
	226	Br	F	F	I	F	H	NH	524
35	227	Cl	F	Cl	F	Cl	H	NH	*
	228	Cl	F	F	F	Cl	H	NH	*
	229	Br	F	F	F	Cl	H	NH	*
	230	F	Cl	F	F	Cl	H	NH	*
	231	F	Cl	Cl	F	Cl	H	NH	*
40	232	Cl	F	H	F	Br	H	NH	*
	233	Cl	F	Cl	F	Br	H	NH	*
	234	Cl	F	F	F	Br	H	NH	*
	235	Br	F	F	F	Br	H	NH	*
	236	F	Cl	F	F	Br	H	NH	*
	237	F	Cl	Cl	F	Br	H	NH	*
	238	Cl	F	F	F	-CN	H	NH	*
45	239	Cl	H	F	Cl	F	H	NH	*
	240 (Пп. 7)	Cl	H	F	Br	F	H	NH	414
	241	Br	H	F	Cl	F	H	NH	414
	242	Br	H	H	Br	F	H	NH	440
	243	I	H	H	Br	F	H	NH	488

	244	Br	H	F	Br	F	H	NH	*
	245	Br	H	F	F	F	H	NH	*
	246	I	H	H	F	F	H	NH	426
	247	Br	H	F	F	H	F	NH	*
5	248	Cl	F	H	F	-CN	H	NH	***
	249	Cl	F	Cl	F	-CN	H	NH	*
	250	-CN	F	F	F	-CN	H	NH	*
	251	Cl	H	Cl	F	F	H	NH	367
	252	Me	H	F	Cl	F	H	NH	348
	253	Me	H	Cl	Cl	F	H	NH	364
10	254	Me	H	Br	Cl	F	H	NH	410
	255	Cl	H	Cl	Cl	F	H	NH	*
	256	Cl	H	Cl	Br	F	H	NH	*
	257	Me	H	Cl	F	MeO	H	NH	360

	258	Me	H	Br	F	MeO	H	NH	406
	259	Me	H	F	F	MeO	H	NH	344
15	260	Cl	H	F	F	MeO	H	NH	364
	261	Br	H	F	F	MeO	H	NH	410
	262	Me	H	Cl	Cl	MeO	H	NH	376
	263	Me	H	Br	Cl	MeO	H	NH	422
	264	Cl	H	F	Cl	MeO	H	NH	380
20	265	Me	H	Br	F	F	H	NH	394
	266	Me	H	Br	Br	F	H	NH	454
	267	Me	H	F	Br	F	H	NH	394
	268	Me	H	F	F	F	H	NH	332
	269	Me	H	Cl	F	F	H	NH	348
	270	Me	H	Me	F	F	H	NH	328
25	271	Me	H	Me	Cl	F	H	NH	344
	272	Cl	H	H	Br	F	H	NH	396
	273	Br	H	F	Cl	MeO	H	NH	426
	274	Br	H	H	Cl	F	H	NH	396
	275	Cl	H	F	F	F	H	NH	352
	276	Me	H	Cl	Br	F	H	NH	410

\* Данные точки плавления (MP) перечислены в таблице индексов В.

30 \*\* Данные AP<sup>+</sup> или данные <sup>1</sup>H ЯМР перечислены в примерах синтеза.

\*\*\* Данные <sup>1</sup>H ЯМР перечислены в таблице индексов С.

† Наблюдали пик исходного иона (M), не M+1.

‡ Также наблюдали пик 402 (M+2).

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ В

	№ соед.	Точка плавления а	№ соед.	Точка плавления	№ соед.	Точка плавления
35	31	80-82	72	172-174	156	181-183
	35	160-162	75	132-135	157	155-157
	36	228-230	76	132-134	227	183-184
	40	93-95	83	181-183	228	180-182
	49	110-112	89	178-180	229	154-155
40	50	105-107	90	168-170	230	190-191
	51	130-132	91	101-105	231	154-155
	60	109-111	114	137-139	238	177-179
	61	57-59	115	151-153	239	166-168
	63	133-135	124	169-171	244	154-156
	66	91-93	125	111-113	245	149-151
45	67	82-84	132	229-231	247	127-129
	68	182-184	232	88-89	249	200-202
	69	156-158	233	186-187	250	200-202
	71	171-173	234	182-183	255	183-185
	105	118-120	235	167-169	256	199-201
	109	117-119	236	199-201		

113	135-136	237	160-162		
-----	---------	-----	---------	--	--

<sup>a</sup> Данные точки плавления представлены в °С.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ С	
№ соед.	Данные <sup>1</sup> H ЯМР (раствор CDCl <sub>3</sub> , если не указано иное) <sup>a</sup>
15	δ 6,74 (м, 2H), 6,30 (м, 2H), 3,83 (с, 3H), 3,75 (с, 3H), 2,03 (с, 3H).
193	δ 7,01 (м, 1H) 6,79 (ддд, 1H) 6,63 (м, 3 H) 6,34 (тд, 1H) 5,34 (шир. с, 1H) 3,99 (м, 2H) 3,68 (с, 3H) 2,23 (с, 3H) 1,39 (м, 3H).
248	δ 7,30 (м, 2H), 7,25-7,30 (м, 1H), 7,08 (м, 1H), 6,76 (м, 1H), 6,28 (м, 1H), 5,67 (шир. с, 1H), 3,69 (с, 3H), 2,27 (с, 3H).

<sup>a</sup> Данные <sup>1</sup>H ЯМР приводятся в м.д. слабого поля от тетраметилсилана. Взаимодействия обозначены путем (с)-синглета, (шир. с)-широкого синглета, (ддд)-дублета дублетов дублетов, (тд)-триплета дублетов и (м)-мультиплета

## 10 БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

Общий протокол для получения тестируемых суспензий для тестов А-І: тестируемые соединения вначале растворяли в ацетоне в количестве, равном 3% конечного объема, и затем суспендировали в желательной концентрации (в ч/млн) в ацетоне и очищенной воде (смесь 50/50 по объему), включая 250 ч/млн поверхностно-активного вещества  
 15 Trem® 014 (сложные эфиры многоатомных спиртов). Получающиеся в результате тестируемые суспензии затем применяют в тестах А-І. Каждый тест проводили в трех повторностях, и результаты усредняли. Распыление 200 ч/млн тестируемой суспензии до момента стекания по тестируемым растениям было эквивалентно норме около 800  
 20 г/га. Если не указано иное, номинальные значения указывают, что применяли 200 ч/млн тестируемой суспензии. (Звездочка “\*” после номинального значения указывает, что применяли 40 ч/млн тестируемой суспензии.)

### ТЕСТ А

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам томата. На  
 25 следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Botrytis cinerea* (возбудитель болезни серой гнили томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°С в течение 48 часов, и затем дополнительно перемещали в вегетационную камеру при 24°С на 3 дня, после чего производили визуальные оценки болезни.

### ТЕСТ В

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам томата. На  
 30 следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Alternaria solani* (возбудитель болезни бурой пятнистости томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 27°С в течение 48 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°С на 5 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

### ТЕСТ С

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам томата. На  
 35 следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Phytophthora infestans* (возбудитель болезни фитофтороза томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°С в течение 24 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°С на 5 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

### 40 ТЕСТ D

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам полевицы белой  
 (Agrostis sp.). На следующий день сеянцы инокулировали отрубями и мицелиальной  
 взвесью *Rhizoctonia solani* (возбудитель болезни бурой пятнистости газона) и  
 инкубировали в насыщенной атмосфере при 27°С в течение 48 часов, и затем перемещали  
 45 в вегетационную камеру при 27°С на 3 дня, после чего производили оценки болезни.

### ТЕСТ E

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На  
 следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Septoria nodorum* (возбудитель

болезни септориоза колосковой чешуи) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 24°C в течение 48 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 9 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

#### ТЕСТ F

5 Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Septoria tritici* (возбудитель болезни пятнистости листьев пшеницы) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 24°C в течение 48 часов, а затем сеянцы перемещали дополнительно в вегетационную камеру при 20°C на 19 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

#### 10 ТЕСТ G

Сеянцы пшеницы инокулировали суспензией спор *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (возбудитель болезни листовой ржавчины пшеницы) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 2 дня. По истечении этого времени тестируемую суспензию распыляли до 15 момента стекания, и затем сеянцы перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 4 дня, после чего производили визуальные оценки болезни.

#### ТЕСТ H

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* 20 (возбудитель болезни листовой ржавчины пшеница) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 6 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

#### ТЕСТ I

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На 25 следующий день сеянцы инокулировали спорным порошком *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (также известного как *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, возбудитель болезни настоящей мучнистой росы пшеницы) и инкубировали в вегетационной камере при 20°C в течение 8 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

30 Результаты для тестов А-I приводятся в таблице А. В таблице оценка 100 указывает на 100% контроль болезни, и оценка 0 указывает на отсутствие контроля болезни (относительно контролей). Дефис (-) указывает на отсутствие результатов теста.

ТАБЛИЦА А

№ соед.	Тест А	Тест В	Тест С	Тест D	Тест Е	Тест F	Тест G	Тест H	Тест I
35 1	99	93	0	99	0	100	-	99	100
2	99	100	0	98	64	100	-	100	99
3	100	100	-	-	93	97	96	100	100
4	99	100	-	-	99	95	99	100	100
5	98	100	-	-	97	97*	-	100	99
6	98	100	-	-	99	93	92	100	100
7	98	100	-	-	0	94	9	97	100
40 8	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
9	99	9	-	-	0	97	0	99	99
10	99	0	-	-	0	94	92	99	99
11	100	99	-	-	90	94	0	100	99
45 12	100	0	-	-	0	93	0	94	82
13	100	100	-	-	100	100	7	100	100
14	99	100	-	-	99	100	37	100	99
15	98	100	-	-	89	98	82	100	100
16	99	98	-	-	84	98	98	99	99
17	100	73	-	-	60	99	91	99	100

RU 2 572 202 C2

	18	100	98	-	-	98	99	95	99	97
	19	99	82	-	-	0	98	0	89	91
	20	100	100	-	-	40	99	0	68	13
	21	100	100	-	-	89	99	99	96	94
5	22	100	100	-	-	78	100	98	100	99
	23	100	100	-	-	95	98	85	99	100
	24	99	95	-	-	84	100	0	98	100
	25	100	99	-	-	95	99	0	100	100
	26	100	100	-	-	99	100	41	99	100
	27	99	99	-	-	99	100	9	99	100
10	28	100	17	-	-	69	100	26	99	99
	29	100	99	-	-	97	99	99	99	100
	30	100	99	-	-	90	100	82	99	100
	31	100	98	-	-	99	99	53	100	100
	32	99	97	-	-	82	100	11	98	97
	33	100	100	-	-	98	100	99	100	99
15	34	100	99	9	-	94	100	0	99	99
	35	100	100	-	-	60	99	0	100	94
	36	99	0	-	-	0	99	0	41	0
	37	100	86	-	-	100	100	69	99	100
	38	99	94	-	-	87	99	0	96	97
	39	99	99	-	-	98	100	0	99	100
20	40	99	99	-	-	100	100	63	100	100
	41	100	99	-	-	100	100	92	100	99
	42	98	99	-	-	0	99	8	100	100

	43	98	100	-	-	0	100	95	100	98
	44	99	0	-	-	0	99	8	98	94
25	45	100	99	0	-	99	98	0	100	99
	46	100	100	-	-	87	100	0	99	100
	47	100	99	0	-	82	96	93	99	100
	48	100	100	-	-	73	98	0	83	100
	49	100	100	-	-	80	98	0	83	100
	50	100	99	-	-	73	95	0	93	100
30	51	100	99	-	-	0	98	0	68	100
	52	94	44	-	-	0	100	0	60	98
	53	97	99	-	-	87	100	0	95	99
	54	97	100	-	-	67	99	27	94	99
	55	99	99	-	-	80	100	94	100	99
	56	98	100	-	-	0	100	0	97	99
35	57	97	100	-	-	73	100	0	99	99
	58	99	100	-	-	0	100	32	99	100
	59	99	94	0	-	73	100	9	98	98
	60	99	97	-	-	20	100	18	97	99
	61	100	93	-	-	64	100	0	99	100
	62	100	100	-	-	99	100	0	99	99
40	63	99	99	-	-	0	99	0	80	99
	64	99	99	-	-	0	100	0	97	100
	65	100	99	-	-	99	100	0	100	100
	66	99	37	-	-	0	100	0	91	100
	67	100	64	-	-	0	100	0	97	100
	68	99	51	-	-	0	100	0	80	100
45	69	100	99	-	-	60	100	0	99	100
	70	99	26	-	-	73	100	0	99	100
	71	99	99	-	-	96	100	0	99	100
	72	100	99	-	-	0	100	0	97	98
	73	100	99	-	-	78	100	90	100	100
	74	100	100	-	-	98	100	0	100	100

RU 2 572 202 C2

	75	100	99	-	-	99	100	0	99	98
	76	100	97	-	-	99	99	0	99	99
	77	99	98	-	-	0	99*	0	99	100
5	78	99	65	-	-	0	99*	9	99	100
	79	99	99	-	-	100	100*	28	100	100
	80	98	0	-	-	60	100*	9	99	99
	81	100	99	0	-	90	100	99	100	100
	82	99	100	0	-	100	100	97	100	100
	83	100	99	-	-	87	100	0	100	100
10	84	100	99	-	-	96	100	92	100	100
	85	99	0	-	-	0	100	0	99	99*
	86	100	99	-	-	90	100	0	100	100
	87	100	93	-	-	87	100	0	100	100
	88	100	95	-	-	51	100*	41	100	100
	89	100	99	-	-	82	100	9	99	100
15	90	99	87	-	-	87	100	0	98	99
	91	99	99	-	-	94	100	0	99	99
	92	100	99	-	-	99	100	0	99	96
	93	100	0	-	-	60	100	0	99	91
	95	100	97	-	-	51	100	91	100	100
	96	100	95	-	-	0	100	94	100	100
20	97	99	99	-	-	0	100	0	96	100
	98	99	0	-	-	0	99	9	99	96
	99	99	0	-	-	0	100	0	97	89
	100	92	88	-	-	100	100	0	99	95
	101	100	93	-	-	0	100	99	100	100
	102	98	0	-	-	0	98	0	94	95*
25	103	99	83	-	-	0	100	63	99	99
	104	100	0	-	-	0	100	0	97	99
	105	99	0	-	-	0	100	0	96	99
	107	100	80	-	-	73	100	8	100	97
	109	100	0	-	-	0	100	0	97	100
	111	100	97	-	-	95	100	94	100	99
30	112	100	37	-	-	40	100	8	100	99
	113	100	0	-	-	0	100	0	98	100
	114	99	0	-	-	0	100	0	91	100
	115	99	0	-	-	0	99	0	99	93
	116	100	33	-	-	99	100	0	100	100
35	117	100	100	-	-	97	100	91	100	100
	118	100	93	-	-	69	100	75	97	100
	119	99	94	-	-	94	100	0	91	99
	120	100	80	-	-	94	100	19	100	100
	122	100	99	-	-	92	100	96	100	99
	123	100	86	-	-	60	100	6	100	95
40	124	97	17	-	-	0	99	3	99	99
	125	99	0	-	-	0	100	82	98	100
	126	100	86	-	-	87	100	0	99	100
	127	99	0	-	-	0	100	0	97	97
	128	100	99	-	-	97	100	0	100	99
	129	100	97	-	-	95	100	79	100	100
45	130	100	90	-	-	0	100	0	100	100
	131	100	0	-	-	0	100	0	96	96
	132	93 (Примечание 1)	0	-	-	0	99	0	96	43
	133	99	97	-	-	88	100	0	99	100
	134	100	99	-	-	64	100	74	100	100

RU 2 572 202 C2

	135	100	58	-	-	0	100	9	99	100
	136	100	100	0	-	100	100	100	100	100
	137	100	95	-	-	87	100	87	99	100
	138	100	66	0	-	0	100	17	100	99
5	139	82	0	-	-	0	100	9	89	0
	140	67	0	-	-	0	100	9	97	97
	141	99	99	-	-	99	100	97	100	100
	142	100	96	0	-	92	100	0	100	100
	143	100	100	0	-	100	100	100	100	100
	144	100	99	-	-	100	100	100	100	100
10	145	99	0	0	-	0	100	0	28	90
	146	-	100	0	-	100	100	74	98	100
	148	100	0	-	-	60	100	0	100	64
	150	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	153	-	0	-	-	0	100	0	96	0
15	154	100	9	-	-	0	100	68	98	99
	155	100	0	-	-	0	100	94	97	99
	156	100	99	-	-	73	100	31	99	99
	157	100	97	0	-	87	100	27	100	99
	158	100*	80*	-	-	0*	99*	37*	98*	96*
	159	100*	97*	-	-	86*	100*	0*	98*	96*
20	160	100	99	-	-	0	100	0	99	100
	161	100	99	0	-	100	99	100	100	100
	162	100	88	0	-	0	100	9	100	100
	163	100*	77*	-	-	60*	100*	91*	100*	100*
	164	99	0	-	-	0	100	99	100	99
	165	100	0	0	-	0	100	67	99	99
25	167	100	0	-	-	0	100	6	92	98
	168	0	0	-	-	0	100	97	91	48
	169	100	0	-	-	60	100	23	96	99
	170	65	0	-	-	0	100	79	98	79
	172	100	73	-	-	60	100	0	100	100
	173	100	0	-	-	40	100	0	99	99
30	174	95	0	-	-	0	100	0	99	99*
	175	100	97	-	-	73	100	41	100	100
	177	99	0	-	-	0	-	0	0	48
	178	100	33	-	-	0	-	98	100	74
	179	96	16	-	-	0	-	9	99	0
	180	100	100	9	-	99	100	98	100	100
35	181	100	99	-	-	99	100	99	99	100
	182	100	100	-	-	100	100	100	100	100
	183	100	0	-	-	0	100	54	96	98
	184	100	58	-	-	60	100	0	98	100
	185	100	99	0	-	60	100	0	99	100
40	186	100	100	0	-	100	100	100	100	100
	187	100	100	0	-	89	-	32	100	100
	188	100	99	0	-	92	-	0	98	98
	189	100	88	0	-	90	-	0	98	98
	190	100	82	0	-	0	-	9	96	95
	191	100	99	0	-	92	-	46	99	99
45	192	33	66	0	-	0	100	0	65	35
	193	-	58	-	-	0	100	0	27	92
	194	-	93	-	-	87	100	0	95	63
	195	99	100	0	-	99	100	89	100	100
	196	100	100	0	-	95	100	0	94	100
	197	100	77	-	-	0	100	9	97	94

RU 2 572 202 C2

	198	100	100	-	-	60	100	9	80	96
	199	100	100	68	-	69	100	0	83	99
	200	98	97	31	-	0	100	0	86	79
	201	100	100	-	-	99	100	98	100	97
5	202	99	77	-	-	0	100	35	92	95
	203	95	100	-	-	73	100	79	100	98
	204	99	99	-	-	99	100	99	100	100
	205	59	31	-	-	0	100	0	99	21
	206	99	100	-	-	99	100	0	99	100
	207	94	99	-	-	86	100	0	94	99
10	208	18	0	-	-	0	99	0	85	27
	209	98	95	-	-	0	100	0	92	100
	210	3	0	-	-	0	100	0	97	0
	211	98	99	-	-	99	100	82	100	100
	212	98	100	-	-	100	100	97	100	100
	213	100	100	-	-	100	100	100	100	100
15	214	100	100	-	-	99	100	99	99	100
	215	100	100	-	-	99	100	100	100	100
	216	100	0	-	-	60	100	18	95	99
	217	100	58	-	-	86	100	41	99	99
	218	100	68	-	-	86	100	0	99	99
	219	100	100	-	-	100	100	99	100	99
20	220	100	69	-	-	73	100	0	97	96
	221	100	100	-	-	97	100	73	99	100
	222	98	77	-	-	0	100	0	90	96
	223	98	88	-	-	0	100	0	97	99
	224	-	100	-	-	89	100	54	100	94
25	225	99	68	-	-	0	100	0	99	100
	226	97	97	-	-	60	100	0	99	100
	227	0	0	-	-	0	100	0	95	96
	228	68	40	-	-	0	100	0	96	81
	229	99	99	-	-	64	100	9	97	98
	230	40	0	-	-	0	100	0	94	95
30	231	33	58	-	-	0	100	9	94	99
	232	79	-	-	-	-	100	-	90	99
	233	36	-	-	-	-	100	-	91	89
	234	97	-	-	-	-	100	-	91	79
	235	99	-	-	-	-	100	-	96	90
	236	47	-	-	-	-	100	-	28	0
	237	99	-	-	-	-	100	-	92	95
35	238	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	239	100	100	0	-	99	100	100	100	99
	240	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	241	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	242	99*	-	-	-	-	100*	-	96*	99*
40	243	100	-	-	-	-	100	-	99	100
	244	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	245	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	246	100	-	-	-	-	100	-	98	99
	247	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	248	99	-	-	-	-	100	-	99	99
	249	100	-	-	-	-	100	-	98	92
45	250	0	-	-	-	-	100	-	100	89
	251	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	252	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	253	100	-	-	-	-	100	-	100	100

	254	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	255	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	81*
	256	99*	-	-	-	-	100*	-	95*	64*
	257	100*	-	-	-	31*	100*	-	63*	27*
5	258	100*	-	-	-	0*	100*	-	9*	0*
	259	100*	-	-	-	0*	100*	-	82*	90*
	260	100*	-	-	-	0*	100*	-	85*	90*
	261	-	-	-	-	0*	100*	-	97*	95*
	262	97*	-	-	-	0*	100*	-	85*	79*
	263	99*	-	-	-	0*	100*	-	79*	13*
10	264	100*	-	-	-	0*	100*	-	97*	81*
	265	100	-	-	-	-	100	-	99	100
	266	99	-	-	-	-	100	-	99	99
	267	100	-	-	-	-	100	-	100	100
	268	100	-	-	-	-	100	-	99	100
	269	100	-	-	-	-	100	-	99	100
15	270	98*	-	-	-	-	100*	-	41*	91*
	271	99*	-	-	-	-	100*	-	97*	98*
	272	100	-	-	-	-	100	-	99	100
	275	100	99	0	-	60	100	9	95	100
	276	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	92*
"№ соед." означает номер соединения. Примечание 1: в более раннем тесте оценка составила "65".										

20

### ТЕСТЫ К, L и M

Общий протокол получения тестируемых композиций для тестов К, L и M были следующими. Соединение 81, биксафен, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин (BAS600), ципроконазол, изопиразам, пентиопирад, пробеназол, квиноксифен и спироksamин получили в виде несоставленных материалов технической чистоты. Азоксистробин, боскалид, хлороталонил, гидроксид меди, цимоксанил, дифеноконазол, диметоморф, эпоксиконазол, фенпропиморф, флуазинам, флудиоксонил, фолпет, ипродион, ипроваликарб, манкозеп, мефеноксам (также известный как металаксил-M), миклобутанил, пикоксистробин, проквиназид, протиоконазол, пираклостробин, тетраконазол и трициклозол получили в виде составленных продуктов, продаваемых под торговыми названиями AMISTAR, ENDURA, BRAVO, KOCIDE, CURZATE, SCORE, ACROBAT, OPUS, CORBEL, OMEGA, MAXIM, PHALTAN, ROVRAL, MELODY, MANZATE, RIDOMIL GOLD, NOVA, ACANTO, TALIU, PROLINE, HEADLINE, DOMARK и BEAM, соответственно. Несоставленные материалы вначале растворили в ацетоне и затем суспендировали в желательной концентрации (в ч/млн) в ацетоне и очищенной воде (смесь 50/50 по объему), включая 250 ч/млн поверхностно-активного вещества Trem® 014 (сложные эфиры многоатомных спиртов). Составленные материалы диспергировали в достаточном количестве воды с получением желательной концентрации, и к суспензии не добавляли ни органический растворитель, ни поверхностно-активное вещество. Получающиеся в результате тестируемые смеси затем применяли в тестах К, L и M. Распыление 200 ч/млн тестируемой суспензии до момента стекания по тестируемым растениям было эквивалентно норме около 800 г/га. Тесты повторяли трижды, и результаты сообщаются как среднее значение трех повторностей.

Присутствие синергического эффекта между двумя активными ингредиентами устанавливали с помощью уравнения Колби (см. Colby, S. R. "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds, (1967), 15, 20-22):

$$p = A + B - \left[ \frac{A \times B}{100} \right].$$

При применении способа Колби присутствие синергического взаимодействия между двумя активными ингредиентами устанавливается сначала вычислением предположительной активности,  $p$ , смеси на основе активностей двух компонентов, наносимых отдельно. Если  $p$  ниже экспериментально установленного эффекта, то происходит синергизм. В уравнении выше  $A$  представляет собой фунгицидную активность в процентном отношении к контролю для одного компонента, наносимого отдельно при норме  $x$ . Элемент  $B$  представляет собой фунгицидную активность в процентном отношении к контролю для второго компонента, наносимого при норме  $y$ . Уравнение подсчитывает  $p$ , ожидаемую фунгицидную активность смеси  $A$  при норме  $x$  с  $B$  при норме  $y$ , если их эффекты строго совокупные и не происходило взаимодействие.

ТЕСТ К (т.е. тесты К1, К2, К3, К4, К5)

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На следующий день сеянцы инокулировали спорным порошком *Blumeria graminis* f. sp. *tritici*, (также известный как *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, возбудитель болезни настоящей мучнистой росы пшеницы) и инкубировали в вегетационной камере при 20°C в течение 7 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

ТЕСТ L (т.е. тесты L1, L2, L3, L4, L5)

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (возбудитель болезни листовой ржавчины пшеницы) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов, и затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 6 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

ТЕСТ М (т.е. тесты М1, М2, М3, М4, М5)

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания по сеянцам пшеницы. На следующий день сеянцы инокулировали суспензией спор *Septoria tritici* (возбудитель болезни пятнистости листьев пшеницы) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 24°C в течение 48 часов, а затем сеянцы перемещали дополнительно в вегетационную камеру при 20°C на 19 дней, после чего производили визуальные оценки болезни.

Результаты для тестов К-М представлены в следующих таблицах В-К. Оценка 100 указывает на 100% контроль болезни, а оценка 0 указывает на отсутствие контроля болезни (относительно контролей). Дефис (-) указывает на отсутствие результатов теста. Колонки, помеченные “набл.”, указывают на среднее значение результатов, наблюдаемых из трех повторностей. Колонки, помеченные “ожид.”, указывают на ожидаемый эффект для каждой смеси обработки, рассчитанный с применением уравнения Колби.

ТАБЛИЦА В						
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с квиноксифеном, пробеназолом, манкозобом, ипродиноном, боскалидом, гидроксидом меди, цимоксанилом или проквиназидом в отношении контроля настоящей мучнистой росы или листовой ржавчины пшеницы						
Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест К1		Тест L1	
			Набл.	Ожид.	Набл.	Ожид.
0	нет	0	0		0	
1	нет	0	0		88	
2	нет	0	87		68	
5	нет	0	99		91	
10	нет	0	100		98	
0	квиноксифен	10			0	

5	0	квиноксифен	40			0	
	0	квиноксифен	200			0	
	2	квиноксифен	10			18	68
	2	квиноксифен	40			23	68
	2	квиноксифен	200			38	68
	5	квиноксифен	10			60	91
	5	квиноксифен	40			41	91
	5	квиноксифен	200			47	91
10	0	пробеназол	10	68		9	
	0	пробеназол	40	21		18	
	0	пробеназол	200	71		18	
	2	пробеназол	10	97	96	54	71
	2	пробеназол	40	99	90	85	74
	2	пробеназол	200	98	96	74	74
	5	пробеназол	10	100	100	92	92
15	5	пробеназол	40	100	99	96	93
	5	пробеназол	200	100	100	94	93
	0	манкозеп	10	0		54	

20	0	манкозеп	40	0		88	
	0	манкозеп	200	0		98	
	2	манкозеп	10	79	87	80	85
	2	манкозеп	40	87	87	91	96
	2	манкозеп	200	84	87	99	99
	5	манкозеп	10	96	99	85	96
	5	манкозеп	40	99	99	98	99
	5	манкозеп	200	99	99	99	100
25	0	ипродиион	10	0		0	
	0	ипродиион	40	0		0	
	0	ипродиион	200	21		0	
	2	ипродиион	10	96	87	27	68
	2	ипродиион	40	92	87	27	68
	2	ипродиион	200	94	90	41	68
30	5	ипродиион	10	99	99	68	91
	5	ипродиион	40	99	99	80	91
	5	ипродиион	200	99	99	85	91
	0	боскалид	10	0		0	
	0	боскалид	40	0		54	
35	0	боскалид	200	0		92	
	2	боскалид	10	0	87	76	68
	2	боскалид	40	0	87	86	85
	2	боскалид	200	64	87	99	97
	5	боскалид	10	86	99	89	91
	5	боскалид	40	94	99	98	96
	5	боскалид	200	97	99	98	99
40	0	гидроксид меди	10	0		0	
	0	гидроксид меди	40	0		0	
	0	гидроксид меди	200	0		0	
	2	гидроксид меди	10	71	87	9	68

45	2	гидроксид меди	40	0	87	0	68
	2	гидроксид меди	200	0	87	0	68
	5	гидроксид меди	10	97	99	41	91
	5	гидроксид меди	40	94	99	18	91
	5	гидроксид меди	200	93	99	41	91
	0	цимоксанил	10	0		0	
	0	цимоксанил	40	0		0	
	0	цимоксанил	200	50		18	

5	2	цимоксанил	10	73	87	9	68
	2	цимоксанил	40	89	87	9	68
	2	цимоксанил	200	91	93	54	74
	5	цимоксанил	10	96	99	18	91
	5	цимоксанил	40	98	99	54	91
	5	цимоксанил	200	97	100	74	93
	0	проквиназид	10			0	
	0	проквиназид	40			0	
	0	проквиназид	200			0	
	10	2	проквиназид	10			0
2		проквиназид	40			18	68
2		проквиназид	200			27	68
5		проквиназид	10			18	91
5		проквиназид	40			27	91
5		проквиназид	200			68	91

15 ТАБЛИЦА С  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с хлороталонил, трициклазол, флуазинам, диметоморф, флудиоксонил, ипровакариб, металаксил-М или фолпетом в отношении контроля настоящей мучнистой росы или листовой ржавчины пшеницы

Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест K2		Тест L2		
			Набл.	Ожид.	Набл.	Ожид.	
20	0	нет	0	63	0		
	1	нет	0	91	9		
	2	нет	0	91	27		
	5	нет	0	91	74		
	10	нет	0	100	91		
25	0	хлороталонил	10	58	0		
	0	хлороталонил	40	68	41		
	0	хлороталонил	200	79	91		
	2	хлороталонил	10	92	96	18	27
	2	хлороталонил	40	100	97	85	57
	2	хлороталонил	200	97	98	96	93
30	5	хлороталонил	10	100	96	66	74
	5	хлороталонил	40	100	97	88	85
	5	хлороталонил	200	100	98	96	98
	0	трициклазол	10	0	0		
35	0	трициклазол	40	29	0		
	0	трициклазол	200	79	0		
	2	трициклазол	10	99	91	27	27
	2	трициклазол	40	99	94	27	27
	2	трициклазол	200	98	98	27	27
	5	трициклазол	10	100	91	55	74
	5	трициклазол	40	100	94	68	74
	5	трициклазол	200	100	98	80	74

40	0	флуазинам	10	85		18	
	0	флуазинам	40	96		41	
	0	флуазинам	200	100		74	
	2	флуазинам	10	84	99	41	41
	2	флуазинам	40	99	100	68	57
	2	флуазинам	200	99	100	91	81
45	5	флуазинам	10	100	99	80	79
	5	флуазинам	40	100	100	80	85
	5	флуазинам	200	100	100	91	93
	0	диметоморф	10	82		9	
	0	диметоморф	40	71		9	
	0	диметоморф	200	82		0	
	2	диметоморф	10	99	98	18	34

5	2	диметоморф	40	100	98	18	34
	2	диметоморф	200	99	98	27	27
	5	диметоморф	10	100	98	60	76
	5	диметоморф	40	100	98	68	76
	5	диметоморф	200	100	98	68	74
	0	флудиоксонил	10	82		0	
	0	флудиоксонил	40	92		0	
	0	флудиоксонил	200	96		9	
	2	флудиоксонил	10	100	98	27	27
	2	флудиоксонил	40	99	99	27	27
10	2	флудиоксонил	200	100	100	27	34
	5	флудиоксонил	10	100	98	41	74
	5	флудиоксонил	40	100	99	55	74
	5	флудиоксонил	200	100	100	74	76
	0	ипроваликарб	10	71		0	
	0	ипроваликарб	40	74		0	
15	0	ипроваликарб	200	56		9	
	2	ипроваликарб	10	100	98	27	27
	2	ипроваликарб	40	100	98	27	27
	2	ипроваликарб	200	99	96	27	34
	5	ипроваликарб	10	100	98	74	74
	5	ипроваликарб	40	100	98	74	74

20	5	ипроваликарб	40	100	98	74	74
	5	ипроваликарб	200	100	96	85	76
	0	металаксил-М	10	56		0	
	0	металаксил-М	40	64		0	
	0	металаксил-М	200	21		0	
	2	металаксил-М	10	96	96	27	27
25	2	металаксил-М	40	99	97	27	27
	2	металаксил-М	200	99	93	27	27
	5	металаксил-М	10	100	96	55	74
	5	металаксил-М	40	100	97	55	74
	5	металаксил-М	200	100	93	68	74
	0	фолпет	10	0		0	
30	0	фолпет	40	0		27	
	0	фолпет	200	21		55	
	2	фолпет	10	93	91	0	27
	2	фолпет	40	96	91	27	47
	2	фолпет	200	66	93	80	67
	5	фолпет	10	100	91	74	74
35	5	фолпет	40	100	91	88	81
	5	фолпет	200	100	93	93	88
	5	фолпет	200	100	93	93	88

ТАБЛИЦА Д

Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с изопиразамом, BAS600, биксафеном, пентиопирадом, спироксамином, миклобутанилом или фенпропиморфом в отношении контроля настоящей мучнистой росы или листовой ржавчины пшеницы

40	Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест К3		Тест L3	
				Набл.	Ожид.	Набл.	Ожид.
	0	нет	0	0		0	
	1	нет	0	0		9	
	2	нет	0	0		9	
	5	нет	0	90		41	

45	10	нет	0	99		88	
	0	изопиразам	0,08	0			
	0	изопиразам	0,4	50			
	0	изопиразам	2	99			
	0	изопиразам	10	99			

	2	изопиразам	0,08	0	0		
	2	изопиразам	0,4	64	50		
	2	изопиразам	2	94	99		
	2	изопиразам	10	100	99		
5	5	изопиразам	0,08	99	90		
	5	изопиразам	0,4	100	95		
	5	изопиразам	2	100	100		
	5	изопиразам	10	100	100		
	0	BAS600	0,08	0		74	
	0	BAS600	0,4	0		88	
10	0	BAS600	2	96		99	
	0	BAS600	10	100		100	
	2	BAS600	0,08	0	0	74	76
	2	BAS600	0,4	0	0	94	89
	2	BAS600	2	93	96	100	99
	2	BAS600	10	99	100	100	100
15	5	BAS600	0,08	100	90	92	84
	5	BAS600	0,4	99	90	99	93
	5	BAS600	2	100	100	100	99
	5	BAS600	10	100	100	100	100
	0	биксафен	0,08	0		9	
	0	биксафен	0,4	0		88	
20	0	биксафен	2	64		99	
	0	биксафен	10	99		100	
	2	биксафен	0,08	0	0	18	17
	2	биксафен	0,4	0	0	80	89
	2	биксафен	2	90	64	99	99
	2	биксафен	10	99	99	100	100
25	5	биксафен	0,08	99	90	68	46
	5	биксафен	0,4	100	90	94	93
	5	биксафен	2	100	96	100	99
	5	биксафен	10	100	100	100	100
30	0	пентипирад	0,08	0			
	0	пентипирад	0,4	0			
	0	пентипирад	2	99			
	0	пентипирад	10	100			
	2	пентипирад	0,08	0	0		
	2	пентипирад	0,4	42	0		
	2	пентипирад	2	99	99		
35	2	пентипирад	10	100	100		
	5	пентипирад	0,08	99	90		
	5	пентипирад	0,4	100	90		
	5	пентипирад	2	100	100		
	5	пентипирад	10	100	100		
40	0	спироксамин	0,4	0		0	
	0	спироксамин	2	0		0	
	0	спироксамин	10	0		0	
	0	спироксамин	40	99		91	
	2	спироксамин	0,4	0	0	18	9
	2	спироксамин	2	0	0	9	9
	2	спироксамин	10	0	0	9	9
45	2	спироксамин	40	100	99	60	92
	5	спироксамин	0,4	97	90	45	41
	5	спироксамин	2	96	90	41	41
	5	спироксамин	10	98	90	80	41
	5	спироксамин	40	100	100	95	95
	0	миклобутанил	0,4	0		0	

0	миклобутанил	2	86		0	
0	миклобутанил	10	99		41	
0	миклобутанил	40	100		99	
2	миклобутанил	0,4	42	0	0	9
2	миклобутанил	2	93	86	0	9
2	миклобутанил	10	100	99	41	46
2	миклобутанил	40	100	100	100	99
5	миклобутанил	0,4	98	90	27	41
5	миклобутанил	2	99	99	68	41
5	миклобутанил	10	100	100	93	65
5	миклобутанил	40	100	100	100	99
0	фенпропиморф	0,4	50		0	
0	фенпропиморф	2	96		0	
0	фенпропиморф	10	100		88	
0	фенпропиморф	40	100		100	
2	фенпропиморф	0,4	85	50	0	9
2	фенпропиморф	2	97	96	41	9
2	фенпропиморф	10	100	100	97	89
2	фенпропиморф	40	100	100	100	100
5	фенпропиморф	0,4	96	95	54	41
5	фенпропиморф	2	100	100	83	41
5	фенпропиморф	10	100	100	99	93
5	фенпропиморф	40	100	100	100	100

ТАБЛИЦА Е  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с дифеноконазолом, азоксистробин, тетраконазолом, пираклостробин, протиоконазолом, пикоксистробин или эпоксиконазолом в отношении контроля настоящей мучнистой росы или листовой ржавчины пшеницы

Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест K4		Тест L4	
			Набл.	Ожид.	Набл.	Ожид.
0	нет	0	0		0	
1	нет	0	0		0	
2	нет	0	0		27	
5	нет	0	0		68	
10	нет	0	-		88	
0	дифеноконазол	0,08	0			

0	дифеноконазол	0,4	0			
0	дифеноконазол	2	81			
0	дифеноконазол	10	99			
2	дифеноконазол	0,08	0	0		
2	дифеноконазол	0,4	21	0		
2	дифеноконазол	2	90	81		
2	дифеноконазол	10	100	99		
5	дифеноконазол	0,08	98	0		
5	дифеноконазол	0,4	97	0		
5	дифеноконазол	2	98	81		
5	дифеноконазол	10	100	99		
0	азоксистробин	0,08	0			
0	азоксистробин	0,4	0			
0	азоксистробин	2	0			
0	азоксистробин	10	96			
2	азоксистробин	0,08	0	0		
2	азоксистробин	0,4	0	0		
2	азоксистробин	2	0	0		
2	азоксистробин	10	97	96		
5	азоксистробин	0,08	97	0		
5	азоксистробин	0,4	96	0		

5	5	азоксистербин	2	98	0		
	5	азоксистербин	10	100	96		
	0	тетраконазол	0,08	0		0	
	0	тетраконазол	0,4	21		0	
	0	тетраконазол	2	93		27	
	0	тетраконазол	10	97		99	
	2	тетраконазол	0,08	0	0	0	27
	2	тетраконазол	0,4	0	21	9	27
	2	тетраконазол	2	55	93	60	47
	2	тетраконазол	10	99	97	100	99
10	5	тетраконазол	0,08	94	0	74	68
	5	тетраконазол	0,4	94	21	74	68
	5	тетраконазол	2	97	93	98	77

15	5	тетраконазол	10	100	97	100	100
	0	пираклостробин	0,08	0		9	
	0	пираклостробин	0,4	0		80	
	0	пираклостробин	2	0		98	
	0	пираклостробин	10	93		100	
	2	пираклостробин	0,08	0	0	27	34
	2	пираклостробин	0,4	0	0	85	85
	2	пираклостробин	2	58	0	97	99
	2	пираклостробин	10	94	93	100	100
	20	5	пираклостробин	0,08	97	0	74
5		пираклостробин	0,4	96	0	94	94
5		пираклостробин	2	98	0	100	99
5		пираклостробин	10	99	93	100	100
25	0	протиоконазол	0,08	0		0	
	0	протиоконазол	0,4	0		0	
	0	протиоконазол	2	0		9	
	0	протиоконазол	10	93		9	
	2	протиоконазол	0,08	0	0	0	27
	2	протиоконазол	0,4	0	0	0	27
	2	протиоконазол	2	47	0	0	34
	2	протиоконазол	10	98	93	27	34
30	5	протиоконазол	0,08	96	0	80	68
	5	протиоконазол	0,4	96	0	74	68
	5	протиоконазол	2	97	0	55	71
	5	протиоконазол	10	98	93	74	71
35	0	пикоксистербин	0,08	0		0	
	0	пикоксистербин	0,4	0		9	
	0	пикоксистербин	2	0		82	
	0	пикоксистербин	10	99		100	
	2	пикоксистербин	0,08	0	0	0	27
	2	пикоксистербин	0,4	0	0	27	34
	2	пикоксистербин	2	42	0	85	87
40	2	пикоксистербин	10	100	99	100	100
	5	пикоксистербин	0,08	93	0	60	68

45	5	пикоксистербин	0,4	95	0	80	71
	5	пикоксистербин	2	96	0	90	94
	5	пикоксистербин	10	100	99	100	100
	0	эпоксиконазол	0,08	0		0	
	0	эпоксиконазол	0,4	90		93	
	0	эпоксиконазол	2	98		99	
	0	эпоксиконазол	10	100		100	
	2	эпоксиконазол	0,08	0	0	55	27
	2	эпоксиконазол	0,4	29	90	97	95

	2	эпоксиконазол	2	99	98	99	99
	2	эпоксиконазол	10	100	100	100	100
	5	эпоксиконазол	0,08	93	0	91	68
	5	эпоксиконазол	0,4	98	90	100	98
5	5	эпоксиконазол	2	100	98	100	100
	5	эпоксиконазол	10	100	100	100	100

ТАБЛИЦА F  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с квиноксифеном, ципроконазолом, пентиопирадом, изопиразамом, дифеноконазолом, азоксистробином или проквиназидом в отношении контроля настоящей мучнистой росы или листовой ржавчины пшеницы

10	Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест K5		Тест L5	
				Набл.	Ожид.	Набл.	Ожид.
	0	нет	0	0		0	
	1	нет	0	0		18	
	2	нет	0	0		27	
	5	нет	0	0		55	
15	10	нет	0	100		82	
	0	квиноксифен	0,016	21		-	
	0	квиноксифен	0,08	29		-	
	0	квиноксифен	0,4	64		-	
	0	квиноксифен	2	93		-	
	2	квиноксифен	0,016	90	21	-	
20	2	квиноксифен	0,08	87	29	-	
	2	квиноксифен	0,4	90	64	-	

	2	квиноксифен	2	99	93	-	
	5	квиноксифен	0,016	99	21	-	
	5	квиноксифен	0,08	100	29	-	
	5	квиноксифен	0,4	100	64	-	
25	5	квиноксифен	2	100	93	-	
	0	ципроконазол	0,016	64		27	
	0	ципроконазол	0,08	64		80	
	0	ципроконазол	0,4	79		92	
	0	ципроконазол	2	96		100	
30	2	ципроконазол	0,016	42	64	55	47
	2	ципроконазол	0,08	64	64	74	85
	2	ципроконазол	0,4	96	79	93	94
	2	ципроконазол	2	100	96	100	100
	5	ципроконазол	0,016	100	64	68	67
	5	ципроконазол	0,08	99	64	97	91
35	5	ципроконазол	0,4	100	79	98	96
	5	ципроконазол	2	100	96	100	100
	0	пентиопирад	0,016	-		9	
	0	пентиопирад	0,08	-		55	
	0	пентиопирад	0,4	-		68	
	0	пентиопирад	2	-		99	
40	2	пентиопирад	0,016	-		55	34

	2	пентиопирад	0,08	-		68	67
	2	пентиопирад	0,4	-		68	77
	2	пентиопирад	2	-		99	99
	5	пентиопирад	0,016	-		74	59
45	5	пентиопирад	0,08	-		80	79
	5	пентиопирад	0,4	-		88	85
	5	пентиопирад	2	-		100	100
	0	изопиразам	0,016	-		68	
	0	изопиразам	0,08	-		89	
	0	изопиразам	0,4	-		100	

	0	изопиразам	2	-	100	
	2	изопиразам	0,016	-	74	77
	2	изопиразам	0,08	-	88	92
	2	изопиразам	0,4	-	100	100
5	2	изопиразам	2	-	100	100
	5	изопиразам	0,016	-	88	85
	5	изопиразам	0,08	-	99	95
	5	изопиразам	0,4	-	100	100
	5	изопиразам	2	-	100	100
10	0	дифеноконазол	0,016	-	68	
	0	дифеноконазол	0,08	-	68	
	0	дифеноконазол	0,4	-	92	

	0	дифеноконазол	2	-	100	
	2	дифеноконазол	0,016	-	27	77
	2	дифеноконазол	0,08	-	41	77
	2	дифеноконазол	0,4	-	99	94
15	2	дифеноконазол	2	-	100	100
	5	дифеноконазол	0,016	-	74	85
	5	дифеноконазол	0,08	-	80	85
	5	дифеноконазол	0,4	-	100	96
	5	дифеноконазол	2	-	100	100
20	0	азоксистробин	0,016	-	0	
	0	азоксистробин	0,08	-	68	
	0	азоксистробин	0,4	-	100	
	0	азоксистробин	2	-	100	
	2	азоксистробин	0,016	-	27	27
	2	азоксистробин	0,08	-	74	77
	2	азоксистробин	0,4	-	100	100
25	2	азоксистробин	2	-	100	100
	5	азоксистробин	0,016	-	74	55
	5	азоксистробин	0,08	-	97	85
	5	азоксистробин	0,4	-	100	100
	5	азоксистробин	2	-	100	100
30	0	проквиназид	0,016	0	-	

	0	проквиназид	0,08	0	-	
	0	проквиназид	0,4	0	-	
	0	проквиназид	2	71	-	
	2	проквиназид	0,016	0	0	
	2	проквиназид	0,08	0	0	
35	2	проквиназид	0,4	0	0	
	2	проквиназид	2	87	71	
	5	проквиназид	0,016	87	0	
	5	проквиназид	0,08	89	0	
	5	проквиназид	0,4	93	0	
	5	проквиназид	2	98	71	
40						

ТАБЛИЦА G					
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с пробеназолом, манкозобом, ипродионом, боскалидом, гидроксидом меди, цимоксанилом или хлороталонилом в отношении контроля пятнистости листьев пшеницы					
Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест M1		
			Набл.	Ожид.	
0	нет	0	0		
0,01	нет	0	0		
0,1	нет	0	0		
1	нет	0	86		
10	нет	0	100		
0	пробеназол	10	0		

	0	пробеназол	40	0	
	0	пробеназол	200	0	
	0,1	пробеназол	10	0	0
	0,1	пробеназол	40	0	0
5	0,1	пробеназол	200	25	0
	1	пробеназол	10	87	86
	1	пробеназол	40	94	86
	1	пробеназол	200	87	86
	0	манкозеп	10	0	
	0	манкозеп	40	55	
10	0	манкозеп	200	91	
	0,1	манкозеп	10	0	0
	0,1	манкозеп	40	63	55
	0,1	манкозеп	200	96	91
	1	манкозеп	10	81	86
	1	манкозеп	40	98	94
15	1	манкозеп	200	100	99
	0	ипродиион	10	0	
	0	ипродиион	40	0	

	0	ипродиион	200	0	
	0,1	ипродиион	10	0	0
	0,1	ипродиион	40	0	0
20	0,1	ипродиион	200	22	0
	1	ипродиион	10	88	86
	1	ипродиион	40	91	86
	1	ипродиион	200	98	86
	0	боскалид	10	77	
	0	боскалид	40	90	
25	0	боскалид	200	99	
	0,1	боскалид	10	72	77
	0,1	боскалид	40	98	90
	0,1	боскалид	200	98	99
	1	боскалид	10	99	97
	1	боскалид	40	100	99
30	1	боскалид	200	100	100
	0	гидроксид меди	10	0	
	0	гидроксид меди	40	45	
	0	гидроксид меди	200	77	
	0,1	гидроксид меди	10	0	0
	0,1	гидроксид меди	40	25	45
35	0,1	гидроксид меди	200	87	77
	1	гидроксид меди	10	72	86
	1	гидроксид меди	40	93	92
	1	гидроксид меди	200	99	97
	0	цимоксанил	10	0	

40	0	цимоксанил	40	0	
	0	цимоксанил	200	0	
	0,1	цимоксанил	10	0	0
	0,1	цимоксанил	40	0	0
	0,1	цимоксанил	200	0	0
	1	цимоксанил	10	96	86
45	1	цимоксанил	40	85	86
	1	цимоксанил	200	96	86
	0	хлороталонил	10	0	
	0	хлороталонил	40	42	
	0	хлороталонил	200	99	

	0,1	хлороталонил	10	0	0
	0,1	хлороталонил	40	75	42
	0,1	хлороталонил	200	98	99
	1	хлороталонил	10	72	86
5	1	хлороталонил	40	80	92
	1	хлороталонил	200	99	100

ТАБЛИЦА Н  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с BAS600, изопиразамом, пентиопирадом, биксафеном или ципроконазолом в отношении контроля пятнистости листьев пшеницы

	Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест M2	
				Набл.	Ожид.
10	0	нет	0	0	
	0,01	нет	0	0	
	0,1	нет	0	0	
	1	нет	0	95	
	10	нет	0	100	
15	0	BAS600	0,016	0	
	0	BAS600	0,08	0	
	0	BAS600	0,4	93	
	0	BAS600	2	100	
	0,1	BAS600	0,02	0	0
20	0,1	BAS600	0,08	38	0
	0,1	BAS600	0,40	96	93
	0,1	BAS600	2	100	100
	1	BAS600	0,02	65	95
	1	BAS600	0,08	85	95
	1	BAS600	0,40	97	100
25	1	BAS600	2	99	100
	0	изопиразам	0,08	0	
	0	изопиразам	0,40	77	
	0	изопиразам	2	93	
	0	изопиразам	10	100	
	0,1	изопиразам	0,08	0	0
30	0,1	изопиразам	0,40	72	77
	0,1	изопиразам	2	-	
	0,1	изопиразам	10	-	
	1	изопиразам	0,08	-	
	1	изопиразам	0,40	80	99
	1	изопиразам	2	-	
35	1	изопиразам	10	100	100
	0	пентиопирад	0,08	0	
	0	пентиопирад	0,40	0	
	0	пентиопирад	2	-	
	0	пентиопирад	10	-	
	0,1	пентиопирад	0,08	0	0
40	0,1	пентиопирад	0,40	17	0
	0,1	пентиопирад	2	-	
	0,1	пентиопирад	10	99	
	1	пентиопирад	0,08	83	95
	1	пентиопирад	0,40	73	95
	1	пентиопирад	2	-	
45	1	пентиопирад	10	99	
	0	биксафен	0,08	0	
	0	биксафен	0,40	33	
	0	биксафен	2	89	
	0	биксафен	10	-	

	0,1	биксафен	0,08	0	0
	0,1	биксафен	0,40	33	33
	0,1	биксафен	2	83	89
	0,1	биксафен	10	100	
5	1	биксафен	0,08	-	
	1	биксафен	0,4	85	97
	1	биксафен	2	-	
	1	биксафен	10	-	
10	0	ципроконазол	0,4	0	
	0	ципроконазол	2	0	
	0	ципроконазол	10	0	
	0	ципроконазол	40	98	
	0,1	ципроконазол	0,4	0	0
	0,1	ципроконазол	2	0	0
	0,1	ципроконазол	10	0	0
	0,1	ципроконазол	40	98	98
15	1	ципроконазол	0,4	73	95
	1	ципроконазол	2	63	95
	1	ципроконазол	10	97	95
	1	ципроконазол	40	100	100

ТАБЛИЦА 1

Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с флудиоксонилем, эпоксиконазолом, трифлюрометазолом, дифеноконазолом или фенпропиморфом в отношении контроля пятнистости листьев пшеницы

Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест МЗ	
			Набл.	Ожид.
	0	нет	0	
	0,01	нет	0	
	0,1	нет	0	
25	1	нет	52	
	10	нет	100	
	0	флудиоксонил	0,08	0
	0	флудиоксонил	0,4	0
	0	флудиоксонил	2	37
	0	флудиоксонил	10	67
30	0,1	флудиоксонил	0,08	0
	0,1	флудиоксонил	0,4	0
	0,1	флудиоксонил	2	30
	0,1	флудиоксонил	10	57
	1	флудиоксонил	0,08	83
	1	флудиоксонил	0,4	45
35	1	флудиоксонил	2	68
	1	флудиоксонил	10	78
	0	эпоксиконазол	0,4	0
	0	эпоксиконазол	2	0
	0	эпоксиконазол	10	76
	0	эпоксиконазол	40	100
40	0,1	эпоксиконазол	0,4	0
	0,1	эпоксиконазол	2	0
	0,1	эпоксиконазол	10	75
	0,1	эпоксиконазол	40	98
45	1	эпоксиконазол	0,4	78
	1	эпоксиконазол	2	78
	1	эпоксиконазол	10	97
	1	эпоксиконазол	40	100
	0	протиокконазол	0,4	0
	0	протиокконазол	2	0
	0	протиокконазол	10	18

	0	протиоконазол	40	85	
	0,1	протиоконазол	0,4	0	0
	0,1	протиоконазол	2	0	0
	0,1	протиоконазол	10	25	18
5	0,1	протиоконазол	40	-	
	1	протиоконазол	0,4	48	52
	1	протиоконазол	2	25	52
	1	протиоконазол	10	73	61
	1	протиоконазол	40	88	93
10	0	дифеноконазол	0,4	0	
	0	дифеноконазол	2	0	
	0	дифеноконазол	10	52	
	0	дифеноконазол	40	95	
	0,1	дифеноконазол	0,4	0	0
	0,1	дифеноконазол	2	0	0
	0,1	дифеноконазол	10	57	52
15	0,1	дифеноконазол	40	98	95
	1	дифеноконазол	0,4	78	52
	1	дифеноконазол	2	50	52
	1	дифеноконазол	10	88	77
	1	дифеноконазол	40	100	97
20	0	фенпропиморф	2	0	
	0	фенпропиморф	10	0	
	0	фенпропиморф	40	0	
	0	фенпропиморф	200	0	
	0,1	фенпропиморф	2	0	0

25	0,1	фенпропиморф	10	0	0
	0,1	фенпропиморф	40	0	0
	0,1	фенпропиморф	200	0	0
	1	фенпропиморф	2	85	52
	1	фенпропиморф	10	75	52
	1	фенпропиморф	40	86	52
	1	фенпропиморф	200	98	52

30 ТАБЛИЦА J  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с пираклостробин, трициклазол, флуазинамом, диметоморфом, ипроваликарбом, металаксилон-М, фолпетом или миклобутанилом в отношении контроля пятнистости листьев пшеницы

Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест М4		
			Набл.	Ожид.	
35	0	нет	0		
	0,01	нет	0		
	0,1	нет	23		
	1	нет	66		
	10	нет	100		
40	0	пираклостробин	10	0	
	0	пираклостробин	40	26	
	0	пираклостробин	200	93	
	0,1	пираклостробин	10	0	23
	0,1	пираклостробин	40	32	43
	0,1	пираклостробин	200	91	94
45	1	пираклостробин	10	79	66
	1	пираклостробин	40	90	75
	1	пираклостробин	200	97	98
	0	трициклазол	10	0	

	0	трициклазол	40	0	
	0	трициклазол	200	0	

	0,1	трициклазол	10	0	23
	0,1	трициклазол	40	0	23
	0,1	трициклазол	200	0	23
	1	трициклазол	10	74	66
5	1	трициклазол	40	93	66
	1	трициклазол	200	74	66
	0	флуазинам	10	0	
	0	флуазинам	40	0	
	0	флуазинам	200	93	
	0,1	флуазинам	10	13	23
10	0,1	флуазинам	40	60	23
	0,1	флуазинам	200	85	95
	1	флуазинам	10	76	66
	1	флуазинам	40	97	66
	1	флуазинам	200	100	98
	0	диметоморф	10	0	
15	0	диметоморф	40	0	
	0	диметоморф	200	0	
	0,1	диметоморф	10	0	23
	0,1	диметоморф	40	0	23
	0,1	диметоморф	200	16	23
	1	диметоморф	10	93	66
20	1	диметоморф	40	91	66
	1	диметоморф	200	0	66
	0	ипроваликаרב	10	0	
	0	ипроваликаרב	40	0	
	0	ипроваликаרב	200	0	
	0,1	ипроваликаרב	10	0	23
25	0,1	ипроваликаרב	40	23	23
	0,1	ипроваликаרב	200	53	23
	1	ипроваликаרב	10	81	66
	1	ипроваликаרב	40	96	66
	1	ипроваликаרב	200	96	66
30	0	металаксил-М	10	0	
	0	металаксил-М	40	0	
	0	металаксил-М	200	0	
	0,1	металаксил-М	10	0	23
	0,1	металаксил-М	40	0	23
	0,1	металаксил-М	200	32	23
35	1	металаксил-М	10	86	66
	1	металаксил-М	40	96	66
	1	металаксил-М	200	96	66
	0	фолпет	10	0	
	0	фолпет	40	73	
	0	фолпет	200	91	
40	0,1	фолпет	10	32	23
	0,1	фолпет	40	86	79
	0,1	фолпет	200	93	93
	1	фолпет	10	91	66
	1	фолпет	40	91	91
	1	фолпет	200	98	97
45	0	миклобутанил	10	0	
	0	миклобутанил	40	44	
	0	миклобутанил	200	74	
	0,1	миклобутанил	10	13	23
	0,1	миклобутанил	40	0	57
	0,1	миклобутанил	200	61	80

1	миклобутанил	10	16	66
1	миклобутанил	40	91	81
1	миклобутанил	200	74	91

ТАБЛИЦА К

Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с квиноксифеном, азоксистробиноном, пикоксистробиноном, тетраконазолом, спироksamин или проквиназидом в отношении контроля пятнистости листьев пшеницы

5

Норма нанесения (ч/млн) соединения 81	Компонент (b)	Норма нанесения (ч/млн) компонента (b)	Тест M5	
			Набл.	Ожид.
0	нет	0	0	
0,01	нет	0	0	
0,1	нет	0	3	
1	нет	0	90	
10	нет	0	100	
0	квиноксифен	10	0	
0	квиноксифен	40	0	
0	квиноксифен	200	8	
0,1	квиноксифен	10	0	3
0,1	квиноксифен	40	0	3
0,1	квиноксифен	200	0	11
1	квиноксифен	10	95	90
1	квиноксифен	40	99	90
1	квиноксифен	200	99	91
0	азоксистробин	10	0	
0	азоксистробин	40	20	
0	азоксистробин	200	50	
0,1	азоксистробин	10	0	3
0,1	азоксистробин	40	3	23
0,1	азоксистробин	200	61	52
1	азоксистробин	10	90	90
1	азоксистробин	40	94	92
1	азоксистробин	200	93	95

10

15

20

25

30

35

40

45

0	пикоксистробин	10	0	
0	пикоксистробин	40	0	
0	пикоксистробин	200	0	
0,1	пикоксистробин	10	0	3
0,1	пикоксистробин	40	0	3
0,1	пикоксистробин	200	0	3
1	пикоксистробин	10	79	90
1	пикоксистробин	40	70	90
1	пикоксистробин	200	85	90
0	тетраконазол	10	0	
0	тетраконазол	40	7	
0	тетраконазол	200	99	
0,1	тетраконазол	10	13	3
0,1	тетраконазол	40	60	10
0,1	тетраконазол	200	99	99
1	тетраконазол	10	87	90
1	тетраконазол	40	99	91
1	тетраконазол	200	100	100
0	спироksamин	10	0	
0	спироksamин	40	3	
0	спироksamин	200	0	
0,1	спироksamин	10	0	3
0,1	спироksamин	40	0	7
0,1	спироksamин	200	7	3
1	спироksamин	10	88	90
1	спироksamин	40	85	90

	1	спироксамин	200	100	90
	0	проквиназид	10	0	
	0	проквиназид	40	0	
	0	проквиназид	200	0	
5	0,1	проквиназид	10	0	3
	0,1	проквиназид	40	0	3
	0,1	проквиназид	200	0	3
	1	проквиназид	10	22	90
	1	проквиназид	40	55	90
	1	проквиназид	200	25	90

10 В таблицах В-К показаны композиции настоящего изобретения, содержащие смеси из представляющего формулу 1 соединения с множеством соединений компонента (b), демонстрирующих в некоторых случаях синергический контроль настоящей мучнистой росы, листовой ржавчины и пятнистости листьев пшеницы. Поскольку контроль не может превышать 100%, повышенную активность сверх ожидаемой фунгицидной

15 активности не всегда наблюдали в смесях, но скорее наблюдали, когда нормы нанесения только отделенных компонентов активных ингредиентов были таковыми, что обеспечивали контроль значительно меньше 100%. Эффект синергии может быть не очевиден при низких нормах нанесения, когда отдельные компоненты активных ингредиентов сами по себе обладают малой активностью. Однако, в некоторых случаях

20 большую активность наблюдали для комбинаций, где отдельные активные ингредиенты сами по себе при тех же нормах нанесения обладали малой активностью или она отсутствовала. Как демонстрируется выше, настоящее изобретение предусматривает способ контроля настоящей мучнистой росы (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*), листовой ржавчиной (*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*) и пятнистости листьев пшеницы (*Septoria tritici*).

#### 25 ТЕСТЫ N1 и N2

Тесты N1 и N2 включают оценку смесей из соединения 81 с 2-[(3-бром-8-метил-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметил-2-пропин-1-ил)-2-(метилтио)ацетамидом (соединение A1) и 2-[(3-бром-6-хинолинил)окси]-N-(1,1-диметилэтил)бутанамидом (соединение A2), соответственно, в отношении ингибирования роста *Septoria tritici* (возбудитель болезни

30 пятнистости листьев пшеницы). Общий протокол получения тестируемых композиций был следующим. Соединение 81 (тесты N1 и N2), соединение A1 (тест N1) и соединение A2 (тест N2) получали в виде насоставленных материалов технической чистоты.

Несоставленные тестируемые соединения сначала растворили в DMSO подходящей концентрации для обеспечения желательной концентрации (в мкМ) после смешивания

35 с ростовой средой для грибов в лунках 96-луночных планшетов, содержащих 200 мкл ростовой среды для грибов на лунку. Диапазоны концентрации соединений выбирали до перекрытия диапазона ингибиторной активности от 0 до примерно 100% для идентификации какого-либо синергического действия, когда *Septoria tritici* обрабатывали соединениями, добавленными в комбинацию. DMSO растворы тестируемых соединений

40 добавляли в лунки перед добавлением ростовой среды для грибов.

Твердую ростовую среду для грибов получали посредством образования водной смеси, содержащей вторичный кислый фосфат калия (3,0 г/л), первичный кислый фосфат калия (4,0 г/л), хлорид натрия (0,5 г/л), хлорид аммония (1,0 г/л), гептагидрат сульфата магния (0,2 г) и дигидрат хлорида кальция (0,01 г/л), также содержащей 1 мл/л раствора следовых элементов (гидрат сульфата марганца (0,1 мг/мл), гептагидрат сульфата цинка (0,2 мг/мл), пентагидрат сульфата меди(II) (0,2 мг/мл), гептагидрат сульфата железа(II) (0,2 мг/мл), дигидрат молибдата натрия (0,1 мг/мл), гептагидрат сульфата кобальта(II) (0,06 мг/мл), борная кислота (0,08 мг/мл)) и дополненной 50 мкл/л базовым раствором

биотина (0,1 мг/мл). рН довели до 6,8 водным 1 М раствором карбоната натрия. Смесь кроме того дополнили 1 г/л дрожжевым экстрактом и добавили геллановую камедь GELRITE (Kelco) (4 г/л). Добавили достаточное количество воды, чтобы довести объем до 90% конечного объема (например, объем 900 мл для получения 1 л ростовой среды для грибов). Смесь проавтоклавировали. При охлаждении до 60°C добавили 100 мл/л водного раствора декстрозы (10 г/л), 500 мкл/л водного раствора ампициллина (100 мг/мл) и 500 мкл/л раствора рифампицина (10 мг/мл в DMSO) для обеспечения конечного объема ростовой среды для грибов, которую затем распределили в теплом состоянии с применением пипетки-дозатора в лунки 96-лунковых планшетов.

Распределенную ростовую среду для грибов в каждой лунке перемешали, применяя наконечник дозирующей пипетки, для ее смешивания с DMSO раствором, содержащим тестируемые соединения.

После того, как ростовая среда для грибов в лунках охладилась до комнатной температуры и затвердела, верхнюю поверхность ростовой среды в каждой лунке инокулировали суспензией гриба, 20 мкл, содержащей  $8 \times 10^4$  клеток. Вслед за 2 часовым периодом просушки в стерильном вытяжном шкафу, планшеты помещали в темный термостат при 25°C на 5 дн.

Рост грибов оценивали на планшет-ридере, установленном для измерения поглощения света 600 нм. Наблюдаемый процент ингибирования роста (набл.) в тестах N1 и N2, а также ожидаемый процент ингибирования роста (ожд.) из расчетов с применением уравнения Колби, перечислены в таблицах L и M, соответственно.

ТАБЛИЦА L Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с соединением A1 в качестве компонента (b) в отношении контроля <i>Septoria tritici</i>			
Норма нанесения соединения 81 (мкМ)	Норма нанесения соединения A1 (мкМ)	Ингибирование, %	
		Набл.	Ожд.
0,2	0	98,0	
0,04	0	93,5	
0,008	0	10,0	
0,0016	0	5,0	
0,00032	0	9,0	
0	0	0	
0	0,2	98,0	
0	0,04	97	
0	0,008	14,5	
0	0,0016	5	
0	0,00032	3	
0	0	0	0
0,2	0,2	98	98
0,2	0,04	98	98
0,2	0,008	98	98
0,2	0,0016	98	98
0,2	0,00032	98	98
0,04	0,2	98	99,0
0,04	0,04	98	99,0
0,04	0,008	98	96,0
0,04	0,0016	94,2	94,0
0,04	0,00032	92	96,0
0,008	0,2	98,0	99,0
0,008	0,04	97,0	99,0
0,008	0,008	62,0	22,0
0,008	0,0016	6,0	14,0

	0,008	0,00032	5,0	13,0
	0,016	0,2	98,0	98,0
	0,016	0,04	97,0	96,0
	0,016	0,008	32,0	18,0
5	0,016	0,0016	5,0	10,0
	0,016	0,00032	9,0	8,0
	0,0032	0,2	98,0	97,0
	0,0032	0,04	94,0	96,0
	0,0032	0,008	8,0	22,0
	0,0032	0,0016	8,0	14,0
10	0,0032	0,00032	6,0	12,0

ТАБЛИЦА М  
Наблюдаемые и ожидаемые эффекты соединения 81 отдельно и в смесях с соединением А2 в качестве компонента (b) в отношении контроля *Septoria tritici*

	Норма нанесения соединения 81 (мкМ)	Норма нанесения соединения А2 (мкМ)	Ингибирование, %	
			Набл.	Ожид.
15	0,2	0	96,0	
	0,04	0	93,5	
	0,008	0	29,0	
	0,0016	0	0,0	
	0,00032	0	0,0	
	0	0	0	
20	0	20	96,0	
	0	4	95,0	
	0	0,8	11,5	
	0	0,16	6,5	
	0	0,032	0,0	
	0	0	0	
25	0,2	20	96	100
	0,2	4	96	100
	0,2	0,8	96	96
	0,2	0,16	96	96
	0,2	0,032	96	96
30	0,04	20	96,0	100
	0,04	4	96,0	100
	0,04	0,8	96,0	94,2
	0,04	0,16	95,5	93,9
	0,04	0,032	95,0	93,5
	0,008	20	96,0	97,2
35	0,008	4	96,0	96,5
	0,008	0,8	68,0	37,2
	0,008	0,16	0,0	33,6
	0,008	0,032	0,0	29,0
	0,016	20	96,0	96,0
	0,016	4	96,0	95,0
40	0,016	0,8	46,5	11,5
	0,016	0,16	6,5	6,5
	0,016	0,032	0,0	0,0
	0,0032	20	96,0	96,0
	0,0032	4	95,0	95,0
	0,0032	0,8	13,0	11,5
45	0,0032	0,16	24,5	6,5
	0,0032	0,032	1,5	0,0

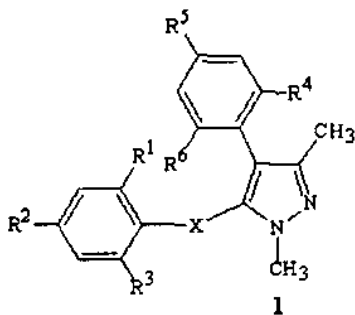
Наблюдаемые и ожидаемые результаты от смесей из соединения 81 и соединения А1 в тесте N1, представленные в таблице L, показывают большую активность, чем ожидаемая (т.е. эффект синергии) при нормах нанесения, где соединение 81 и соединение

А1 по-отдельности обеспечивают намного меньшее, чем 100% ингибирование (для обеспечения возможности выражения синергического увеличения в ингибировании), но также, где нормы нанесения не сильно уменьшены по сравнению с нормами нанесения, обеспечивающими высокое ингибирование посредством соединения 81 и соединения А1 по-отдельности (например, нормы нанесения 0,008 или 0,016 мкМ соединения 81 и норма нанесения 0,008 мкМ соединения А1). Подобным образом, наблюдаемые и ожидаемые результаты от смесей из соединения 81 и соединения А2 в тесте N2, представленные в таблице М, показывают большую активность, чем ожидаемая при нормах нанесения, где соединение 81 и соединение А2 по-отдельности обеспечивают намного меньшее, чем 100% ингибирование, но также, где нормы нанесения не сильно снижены по сравнению с нормами нанесения, обеспечивающими высокое ингибирование посредством соединения 81 и соединения А2 по-отдельности (например, нормы нанесения 0,008 или 0,016 мкМ соединения 81 и норма нанесения 0,8 мкМ соединения А2).

### Формула изобретения

#### 1. Фунгицидная композиция, содержащая:

(а) по меньшей мере одно соединение, выбранное из соединений формулы 1, их N-оксидов и солей:



где

X представляет собой NH;

R<sup>1</sup> представляет собой галоген;

R<sup>2</sup> представляет собой H;

R<sup>3</sup> представляет собой галоген;

R<sup>4</sup> представляет собой галоген;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и

R<sup>6</sup> представляет собой H или галоген; и

(b) по меньшей мере одно добавочное фунгицидное соединение,

при условии, что когда R<sup>1</sup> представляет собой F, то R<sup>3</sup> представляет собой Cl, и когда R<sup>1</sup> представляет собой Cl, то R<sup>3</sup> представляет собой F.

2. Композиция по п. 1, где компонент (а) включает соединение формулы 1 или его соль, где в формуле 1 только один из R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> представляет собой H.

3. Композиция по п. 2, где в формуле 1

R<sup>1</sup> представляет собой F, Cl или Br;

R<sup>2</sup> представляет собой H;

R<sup>3</sup> представляет собой F или Cl;

R<sup>4</sup> представляет собой F, Cl или Br;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, F, Cl или метокси; и

R<sup>6</sup> представляет собой H или F.

5 4. Композиция по п. 3, где в формуле 1

R<sup>3</sup> представляет собой F; и

R<sup>5</sup> представляет собой циано, F, Cl или метокси.

10 5. Композиция по п. 1, где компонент (а) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из:

4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

15 N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

N-(2-хлор-6-фторфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-

амина,

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-фтор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-

20 амина,

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-метоксифенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-

амина, и

N-(2-хлор-6-фторфенил)-4-(2,4-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина.

25 6. Композиция по п. 5, где компонент (а) представляет собой 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин.

7. Композиция по любому из пп. 1-6, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из:

(b1) метилбензимидазолкарбаматных фунгицидов;

(b2) дикарбоксимидных фунгицидов;

30 (b3) фунгицидов-ингибиторов деметилирования;

(b4) фениламидных фунгицидов;

(b5) амин/морфолиновых фунгицидов;

(b6) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза фосфолипидов;

(b7) карбоксамидных фунгицидов;

35 (b8) гидроксид(2-амино-)пиримидиновых фунгицидов;

(b9) анилопиримидиновых фунгицидов;

(b10) N-фенилкарбаматных фунгицидов;

(b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинон-связывающего участка;

(b12) фенилпиррольных фунгицидов;

40 (b13) хинолиновых фунгицидов;

(b14) фунгицидов-ингибиторов перекисного окисления липидов;

(b15) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на редуктазу;

(b16) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на дегидратазу;

(b17) гидроксиданилидных фунгицидов;

45 (b18) фунгицидов-ингибиторов сквален-эпоксидазы;

(b19) полиоксиновых фунгицидов;

(b20) фенилмочевинных фунгицидов;

(b21) фунгицидов-ингибиторов внутреннего хинон-связывающего участка;

(b22) бензамидных фунгицидов;

- (b23) антибиотических фунгицидов на основе енопирануроновой кислоты;  
 (b24) гексопиранозильных антибиотических фунгицидов;  
 (b25) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на синтез белка;  
 (b26) глюкопиранозильных антибиотических фунгицидов, влияющих на трегалазу  
 5 и биосинтез инозитола;  
 (b27) цианоацетамидоксимовых фунгицидов;  
 (b28) карбаматных фунгицидов;  
 (b29) фунгицидов, разобщающих окислительное фосфорилирование;  
 (b30) фунгицидов на основе органических соединений олова;  
 10 (b31) фунгицидов на основе карбоновых кислот;  
 (b32) гетероароматических фунгицидов;  
 (b33) фосфонатных фунгицидов;  
 (b34) фунгицидов на основе фталамовой кислоты;  
 (b35) бензотриазиновых фунгицидов;  
 15 (b36) бензол-сульфонамидных фунгицидов;  
 (b37) пиридазиновых фунгицидов;  
 (b38) тиофен-карбоксамидных фунгицидов;  
 (b39) пиримидинамидных фунгицидов;  
 (b40) фунгицидов на основе амидов карбоновых кислот;  
 20 (b41) тетрациклиновых антибиотических фунгицидов;  
 (b42) тиокарбаматных фунгицидов;  
 (b43) бензамидных фунгицидов;  
 (b44) фунгицидов для индукции защиты растения-хозяина;  
 (b45) фунгицидов с контактной активностью, действующих на множество участков;  
 25 (b46) иных фунгицидных соединений, чем фунгицидные соединения из компонента (а) и компонентов (b1)-(b45); и солей соединений (b1)-(b46).

8. Композиция по п. 7, где компонент (b) содержит по меньшей мере одно фунгицидное соединение из каждой из двух различных групп, выбранных из (b1)-(b46).

9. Композиция по п. 1, где компонент (b) включает по меньшей мере одно соединение,  
 30 выбранное из ацибензолар-S-метила, альдиморфа, аметоктрадина, амисулброма, анилазина, азакназола, азоксистробина, беналаксила, беналаксила-М, беноданила, беномила, бентиаваликарба, бентиаваликарб-изопропила, бетоксазина, бинапакрила, бифенила, битертанола, биксафена, бластицидина-S, боскалида, бромконазола, бупиримата, карбоксина, карпропамида, каптафола, каптана, карбендазима, хлоронеба,  
 35 хлороталонила, хлозолината, клотримазола, солей меди, циазофамида, цифлufenамида, цимоксанила, ципроконазола, ципродинила, дихлофлуанида, диклоцимета, дикломезина, диклорана, диэтофенкарба, дифенокназола, дифлуметорима, диметиримола, диметоморфа, димоксистробина, диниконазола, диниконазола-М, динокапа, дитианона, додеморфа, додина, эдифенфоса, энестробурина, эпоксиконазола, этабоксама,  
 40 этиримола, этридиазола, фамоксадона, фенамидона, фенаримола, фенбуконазола, фенфурама, фенгексамида, феноксанила, фенпиклонила, фенпропилина, фенпропиморфа, фенпиразамина, фентин ацетата, фентин хлорида, фентин гидроксида, фербама, феримзона, флуазинома, флудиоксонила, флуметовера, флуморфа, флуопиколида, флуопирама, фторимида, флуоксастробина, флуквинконазола, флузилазола,  
 45 флусульфамида, флутианила, флутоланила, флутриафола, флуксапироксада, фолпета, фосетил-алюминия, фуберидазола, фуралаксила, фураметпира, гексаконазола, гимексазола, гуазатина, имазадила, имибенконазола, иминоктадина, иодокарба, ипконазола, ипробенфоса, ипродиона, ипроваликарба, изопротиолана, изопиразама,

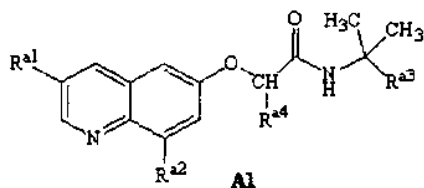
изотианила, касугамицина, крезоксим-метила, манкозеба, мандипропамида, манеба, мепронила, мептилдинокапа, металаксила, металаксила-М, метконазола, метасульфокарба, метирама, метоминостробина, мепанипирима, метрафенона, миклобутанила, нафтифина, нео-азозина (метанарсонат трехвалентного железа),  
 5 нуаримола, октилинона, офураса, орисастробина, оксадиксила, оксолиновой кислоты, окспоконазола, оксикарбоксина, окситетрациклина, пенконазола, пенцикурона, пенфлуфена, пентиопирада, пefуразоата, фосфористой кислоты или ее солей, фталида, пикоксистробина, пипералина, полиоксина, пробеназола, прохлораза, процимидона, пропамокарба, пропамокарб гидрохлорида, пропиконазола, пропинеба, проквиназида,  
 10 протиокарба, протиоконазола, пиракlostробина, пираметостробина, пираоксистробина, пиразофоса, пирибенкарба, пирибутикарба, пирифенокса, пириметанила, пириофенона, пироквиллона, пирролнитрина, хинометионата, квиноксифена, квинтозена, седаксана, силтиофама, симеконазола, спироксамина, стрептомицина, серы, тебуконазола, тебуфлуквина, теклофталама, текназена, тербинафина, тетраконазола, тиабендазола,  
 15 тифлузамида, тиофаната, тиофанат-метила, тирама, тиадинила, толклофос-метила, толилфлуанида, триадимефона, триадименола, триазоксида, трициклазола, тридеморфа, трифлумизола, трициклазола, трифлуксистробина, трифорина, триморфамида, тритиконазола, униканозола, валидамицина, валифеналата, винклозолина, цинеба, цирама, зоксамида, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-  
 20 N-метилметанимидамида, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил) [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидина, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамида, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)-амино]бутанамида, 2-бутоксид-6-йодо-3-пропил-4Н-1-бензопиран-4-она, 3-[5-(4-  
 25 хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил]пиримидина, 4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамата, N-[[[циклопропилметокси)амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метилен]бензолацетамида, α-(метоксиимино)-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензолацетамида, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамида,  
 30 N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-метилбензолсульфонамида, 2-[[[[3-(2,6-дихлорфенил)-1-метил-2-пропен-1-илиден]амино]окси]метил]-α-(метоксиимино)-N-метилбензолацетамида, 1-[(2-пропенилтио)карбонил]-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-5-амино-1Н-пиразол-3-она, 5-этил-6-октил-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-7-иламина, пентил N-[4-[[[[1-метил-1Н-тетразол-5-ил]фенилметилен]амино]окси]метил]-2-тиазолил]  
 35 карбамата и пентил N-[6-[[[[1-метил-1Н-тетразол-5-ил]фенилметилен]амино]окси]метил]-2-пиридинил]карбамата.

10. Композиция по п. 1, где компонент (а) представляет собой 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин; и компонент (б) включает по меньшей мере одно соединение, выбранное из азоксистробина, крезоксим-метила,  
 40 трифлуксистробина, пиракlostробина, пираоксистробина, пираметостробина, пикоксистробина, димоксистробина, метоминостробина/феноминостробина, карбендазима, хлороталонила, квиноксифена, метрафенона, пириофенона, цифлуфенамида, фенпропидина, фенпропиморфа, бромуконазола, ципроконазола, дифенокконазола, эпоксиконазола, фенбуконазола, флузилазола, гексаконазола,  
 45 ипконазола, метконазола, миклобутанила, пенконазола, пропиконазола, проквиназида, протиоконазола, тебуконазола, тритиконазола, фамоксадона, прохлораза, пентиопирада и боскалида (никобифен).

11. Композиция по п. 1 или 10, где компонент (б) включает по меньшей мере одно

соединение, выбранное из хлороталонила, метконазола, протиоконазола и пентиопирада.

12. Композиция по п. 1, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из соединений формулы A1 и их солей



где

$R^{a1}$  представляет собой галоген,  $C_1$ - $C_4$ алкокси или  $C_1$ - $C_4$ алкинил;

$R^{a2}$  представляет собой H, галоген или  $C_1$ - $C_4$ алкил;

15  $R^{a3}$  представляет собой  $C_1$ - $C_{12}$ алкил,  $C_1$ - $C_{12}$ галогеналкил,  $C_1$ - $C_{12}$ алкокси,  $C_2$ - $C_{12}$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_{12}$ алкенил,  $C_2$ - $C_{12}$ алкинил,  $C_4$ - $C_{12}$ алкоксиалкенил,  $C_4$ - $C_{12}$ алкоксиалкинил,  $C_1$ - $C_{12}$ алкилтио или  $C_2$ - $C_{12}$ алкилтиоалкил;

20  $R^{a4}$  представляет собой метил или  $Y^{a1}$ - $R^{a5}$ ;

$R^{a5}$  представляет собой  $C_1$ - $C_2$ алкил; и

$Y^{a1}$  представляет собой  $CH_2$ , O или S.

25 13. Композиция защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, содержащая: (a) по меньшей мере одно соединение, выбранное из соединений формулы 1 по п. 1, их N-оксидов и солей; и по меньшей мере одно соединение или средство для контроля беспозвоночных вредителей.

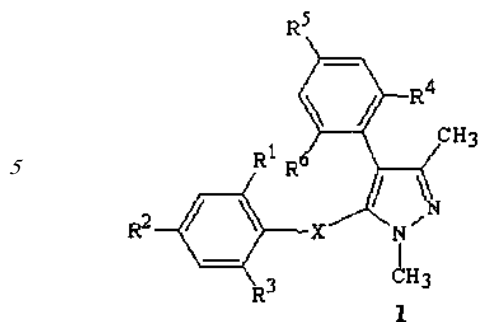
30 14. Состав защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, содержащий композицию по любому из пп. 1-13 и по меньшей мере один добавочный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

15. Способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий нанесение фунгицидно эффективного количества композиции по любому из пп. 1-14 на растение или семя растения.

35 16. Способ защиты растения от настоящей мучнистой росы, включающий нанесение на растение фунгицидно эффективного количества композиции по любому из пп. 1-5, где компонент (b) включает по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из (b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинон-связывающего участка.

40 17. Способ защиты растения от болезни, вызываемой Septoria, включающий нанесение на растение фунгицидно эффективного количества композиции по п. 12.

18. Соединение формулы 1, или его N-оксид, или соль



10 где

X представляет собой NH;

R<sup>1</sup> представляет собой галоген;

R<sup>2</sup> представляет собой H;

15 R<sup>3</sup> представляет собой галоген;

R<sup>4</sup> представляет собой галоген;

R<sup>5</sup> представляет собой H, циано, галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкокси; и

20 R<sup>6</sup> представляет собой H или галоген;

при условии, что если R<sup>1</sup> представляет собой F, то R<sup>3</sup> представляет собой Cl, и если

R<sup>1</sup> представляет собой Cl, то R<sup>3</sup> представляет собой F.

19. Соединение по п. 18, где

R<sup>3</sup> представляет собой F или Cl.

25 20. Соединение по п. 19, где

R<sup>1</sup> представляет собой Cl или Br; и

R<sup>3</sup> представляет собой F.

21. Соединение по п. 18, выбранное из группы, состоящей из:

30 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина,

4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина

и

N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амина.

22. Соединение по п. 21, которое представляет собой 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-  
35 хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин.

23. Фунгицидная композиция, содержащая (1) соединение по любому из пп. 18-22 и (2) по меньшей мере один добавочный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

24. Способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных  
40 патогенными грибами, включающий нанесение фунгицидно эффективного количества соединения по любому из пп. 18-22 на растение или семя растения.

45