ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
---

(19)

المملكة المغربية

المكتب المغربي
للملكية الصناعية و التجارية
---

(12) FASCICULE DE BREVET

(11) N° de publication :
MA 34831 B1

(51) Cl. internationale :
C07D 231/14; A01N 43/56

(43) Date de publication :
02.01.2014

---

(21) N° Dépôt :
36117

(22) Date de Dépôt :
17.07.2013

(30) Données de Priorité :
20.12.2010 IT MI2010A 002328

(86) Données relatives à l'entrée en phase nationale selon le PCT :
PCT/EP2011/073225 19.12.2011

(71) Demandeur(s) :
STITCHING I-F PRODUCTCOLLABORATION, PRINS BERNAHARDPEIN 200 NL-1097 JB AMSTERDAM (NL)

(72) Inventeur(s) :
VENTURINI, Isabella ; VAZZOLA, Matteo Santino ; SINANI, Entela ; PELLACINI, Franco ; FILIPPINI, Lucio

(74) Mandataire :
ABU-GHAZALEH INTELLECTUAL PROPERTY (TMP AGENTS)

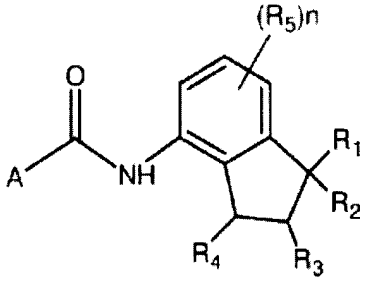
---

(54) Titre : **AMIDES D'AMINOINDANES PRESENTANT UNE FORTE ACTIVITE FONGICIDE ET LEURS COMPOSITIONS PHYTOSANITAIRES**

(57) Abrégé : La présente invention concerne de nouveaux amides d'aminoindanes de formule générale (I), les compositions phytosanitaires correspondantes et leur emploi dans la maîtrise des champignons phytopathogènes.

مركبات أميد أمينو إندان لها نشاط عالي مضاد للفطريات وتركيباتها النباتية الصحية

الملخص



(I)

يتعلق الاختراع الحالي بوصف مركبات أميد أمينو إندان جديدة، لها الصيغة العامة (I)، والتركيبات النباتية الصحية ذات الصلة واستخدامها للسيطرة على الفطريات المُمرِضة للنبات.

MA 34831B1

N°36117
du 17.07.2013

02 JAN 2014

مركبات أميد أمينو إندان لها نشاط عالي مضاد للفطريات وتركيباتها النباتية الصحية

المجال التقني للاختراع

يتعلق الاختراع الحالي بمركبات أميد جديدة لـ 4- أمينو إندان ذات نشاط عالي مضاد للفطريات، والتركيبات الصحية النباتية ذات الصلة واستخدامها في السيطرة على الفطريات المُمرِضة للنبات.

وبصورة أكثر تحديداً، يتعلق الاختراع بمركبات أميد جديدة لـ 4- أمينو إندان، بها استبدال آخر بمجموعات نوعية على مجموعة فينيل لإندان، ولها نشاط عالي في السيطرة على الفطريات المُمرِضة لمحاصيل زراعية هامة.

الخلفية التقنية للاختراع

تم وصف مركبات الأميد التي يتم الحصول عليها من أحماض بنزويك أو أحماض سايكليل كربوكسيلية غير متجانسة مكثفة باستخدام مركبات 4- أمينو إندان في طلبات براءات الاختراع اليابانية JP1070479، JP 1117864، JP1313402، JP2157266، JP2249966، JP3077381، JP62096471، وبراءات الاختراع الأوروبية EP199822، EP256503، EP276177، EP280275، EP569912، وبراءات الاختراع الأمريكية US5093347، والطلبات الدولية WO2001/ 53259، WO2004 / 018438، WO2004/039789، WO2004 / 072023، WO2004/103975، WO2005/ 075452.

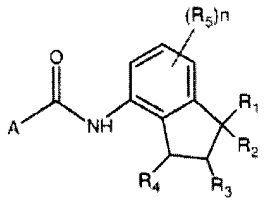
على وجه الخصوص، تصف براءة الاختراع الأوروبية EP199822، 1 ، 3 ، 5- تراي ميثيل- N- (1 ، 1- داي ميثيل-5-فلورو-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد [المركب (4)] و1 ، 5- داي ميثيل-3- تراي فلورو -ميثيل-N- (1 ، 1- داي ميثيل-7-فلورو-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد (صفحة 15، السطور 19-20)؛ وتصف براءة الاختراع الأمريكية US 5,093,347 3- داي فلورو ميثيل-1-ميثيل-N- (1 ، 1 ، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد.

ومع ذلك، لا تعتبر مركبات الأميد لـ 4- أمينو إندان التي تم وصفها في المجال السابق، مُرضية بالكامل من وجهة نظر مستوى النشاط المضاد للفطريات ضد الفطريات المُمرِضة للنبات، ونطاق النشاط، والسُميَّة النباتية فيما يتعلق بالمحاصيل الزراعية المراد حمايتها.

لقد اكتشف مقدم الطلب الآن على نحو مثير للدهشة أن مركبات الأميد الجديدة، التي تم الحصول عليها بواسطة تكثيف أحماض حلقية غير متجانسة بها استبدال بمجموعة CF_2H، مع مركبات 4- أمينو إندان تحتوي على مجموعات ألكيل في المواضع 1 و3 من إندان وواحدة أو أكثر من مجموعات الاستبدال الأخرى على حلقة فينيل، تبدي فيما يتعلق بالمركبات التي تم وصفها أعلاه، نشاط مضاد للفطريات أعلى بكثير، ونطاق نشاط أوسع، وسُميَّة نباتية منخفضة أو معدومة فيما يتعلق بأكثر المحاصيل الزراعية أهمية.

الكشف عن الاختراع

ومن ثم يتعلق الاختراع الحالي بمركبات أمينو إندان أميد لها الصيغة البنائية (I):



(I)

حيث:

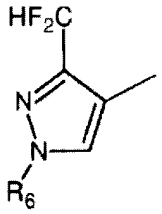
R_1، وR_2، وR_4، تكون مساوية أو مختلفة عن بعضها البعض، وتعبر عن مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، كما يمكن أن ترتبط المجموعتين R_1 وR_2 على نحو محتمل لتكوين مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل تم تكثيفها بمجموعة سبيرو باستخدام إندانيل؛

- R_3 تعبر عن ذرة هيدروجين، مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل؛

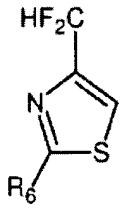
- R_5 تعبر عن ذرة هالوجين، مجموعة C_1-C_4 ألكيل، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو؛

- n تعبر عن عدد صحيح يتراوح من 1 إلى 3؛

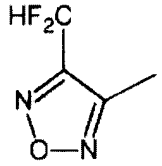
- A تعبر عن واحدة من الحلقات غير المتجانسة التالية A_1-A_5:



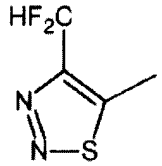
A_1



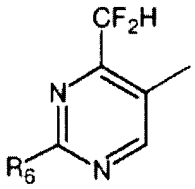
A_2



A_3



A_4



A_5

- R_6 هي مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو.

وتكون أمثلة المركبات ذات الصيغة (I) المثيرة للاهتمام بصورة خاصة بسبب نشاطها هي:

(1) 3- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -1-ميثيل-4-بيرازول كربوكساميد؛

(2) 4- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -2-ميثيل-5-ثيازول كربوكساميد؛

(3) 3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (1، 1، 3، 7-تيترا ميثيل-4-إندانيل) -بيرازول كربوكساميد؛

(4) 4- داي فلورو ميثيل -2-ميثيل-N- (1، 1، 3، 7-تيترا ميثيل-4-إندانيل) -5-ثيازول كربوكساميد؛

(5) 3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7-ميثوكسي-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

(6) 4- داي فلورو ميثيل-2-ميثيل-N- (7-ميثوكسي-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -5-ثيازول كربوكساميد؛

(7) 3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7-ميثيل ثيو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

(8) 4- داي فلورو ميثيل-2-ميثيل-N- (7-ميثيل ثيو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -5-ثيازول كربوكساميد؛

(9) 3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7- تراي فلورو ميثوكسي-1،1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

(10) 4- داي فلورو ميثيل -2-ميثيل-N- (7- تراي فلورو ميثوكسي- 1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -5-ثيازول كربوكساميد؛

(11) 3- داي فلورو ميثيل -N- (7-فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل -4-إندانيل) -4-فيورازان كربوكساميد

(12) 4- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -2-ميثيل ثيو-4-بيريميدين كربوكساميد .

(13) 3- داي فلورو ميثيل-N- (7-كلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل -4-إندانيل) -1-ميثيل-4-بيرازول كربوكساميد؛

(14) 3- داي فلورو ميثيل-N- (7-كلورو-1، 1-داي إيثيل-3-ميثيل-4-إندانيل) -1-ميثيل-4-بيرازول كربوكساميد؛

(15) 4- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل -4-إندانيل) -5-ثياديازول كربوكساميد.

تكون المركبات المفضلة ذات الصيغة العامة (I) هي تلك التي تعبر فيها A عن A_1، R_1، R_2، R_4، و R_6، هي مجموعة ميثيل، وR_3 هي ذرة هيدروجين، وR_5 تعبر عن هالوجين.

أمثلة هالوجين هي: الفلور، والكلور، والبروم، واليود.

أمثلة C_1-C_4 ألكيل، الخطية أو المتفرعة، هي ميثيل، إيثيل، n-بروبيل، أيزو بروبيل، n-بيوتيل، أيزو بيوتيل، sec-بيوتيل، تيرت-بيوتيل.

أمثلة C_1-C_4 هالو ألكيل هي فلورو ميثيل، داي فلورو ميثيل، تراي فلورو ميثيل، كلوروميثيل، داي كلوروميثيل، 2، 2، 2- تراي فلورو إيثيل، 1،1،2،2-تيترا فلورو إيثيل، بنتا فلورو إيثيل، هبتا فلورو بروبيل،4، 4، 4-تراي كلوروبيوتيل .

أمثلة C_1-C_4 ألكوكسي، الخطية أو المتفرعة، هي ميثوكسي، إيثوكسي، n-بروبوكسي، أيزو بروبوكسي، n-بيوتوكسي، أيزو بيوتوكسي، sec-بيوتوكسي، تيرت-بيوتوكسي.

أمثلة C_1-C_4 هالو ألكوكسي هي فلورو ميثوكسي، داي فلورو ميثوكسي، تراي فلورو ميثوكسي، كلوروميثوكسي، داي كلوروميثوكسي، 2، 2، 2- تراي فلورو إيثوكسي، 1، 1، 2، 2-تيترا -فلورو إيثوكسي، 1، 1، 2، 3، 3، 3-هكسا فلورو بروبوكسي، 4،4،4-تراي كلورو بيوتوكسي.

أمثلة C_3-C_6 سايكلو ألكيل هي سايكلو بروبيل، سايكلو بيوتيل، سايكلو بنتيل، سايكلو هكسيل.

أمثلة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل هي 2، 2-داي كلورو-سايكلو بروبيل، 2، 2- داي فلورو سايكلو بروبيل، 2، 2، 3، 3-تيترا فلورو سايكلو بيوتيل، 3، 3- داي فلورو سايكلو بنتيل، 2-فلورو سايكلو هكسيل.

أمثلة C_1-C_4 ألكيل ثيو، الخطية أو المتفرعة، هي ميثيل ثيو، إيثيل ثيو، n-بروبيل ثيو، أيزو بروبيل ثيو، n-بيوتيل ثيو، أيزو بيوتيل ثيو، sec-بيوتيل ثيو، تيرت-بيوتيل ثيو.

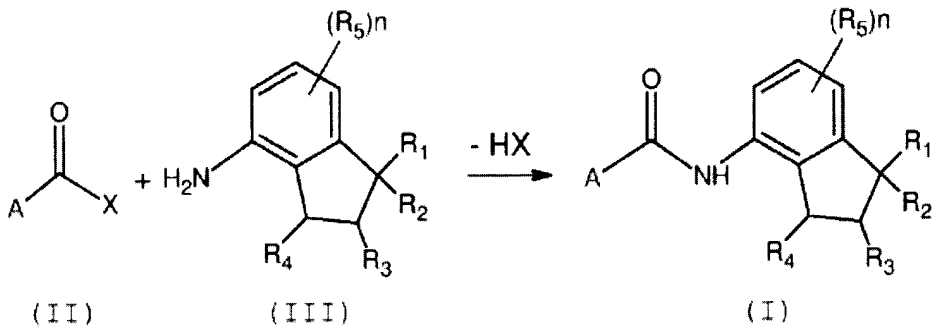
أمثلة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو هي فلورو ميثيل ثيو، داي فلورو ميثيل ثيو، تراي فلورو ميثيل- ثيو، كلوروميثيل ثيو، داي كلوروميثيل ثيو، 2،2،2- تراي فلورو إيثيل ثيو، 1، 1، 2، 2-تيترا -فلورو إيثيل ثيو، 1،1 ،2، 3،3، 3-هكسا فلورو بروبيل- ثيو، 4، 4، 4-تراي كلورو-بيوتيل ثيو.

بسبب عدم التناظر لذرة الكربون في الموضع 3 من حلقة إندانيل وعلى نحو محتمل الذرات في الموضع 1 (عندما تكون R_1 مختلفة عن R_2) و2 (عندما تكون R_3 مختلفة عن الهيدروجين)، يمكن أن تحدث المركبات ذات الصيغة (I) على هيئة خلائط من أيزومرات ضوئية وعلى نحو محتمل مزدوجات تجاسم.

ولهذا يمكن تضمين المركبات ذات الصيغة (I) في مجال الاختراع الحالي على هيئة كل من خلائط راسيمية وعلى نحو محتمل مزدوجات تجاسم، على هيئة كل من خلائط منفصلة جزئياً، إما على هيئة أيزومرات ضوئية منفردة وعلى نحو محتمل على هيئة مزدوجات تجاسم منفردة.

يتم تحضير المركبات ذات الصيغة (I) بواسطة تفاعل حمض به استبدال أو واحد من مشتقاته له الصيغة (II)، مع أنيلين له الصيغة (III)، وفقاً لمخطط التفاعل الموضح أدناه:

المخطط 1



في هذه الصيغ:

يكون لكل من A، R_1، R_2، R_3، R_4، R_5، و n المعاني المحددة سابقاً؛

تعبر X عن هيدروكسي OH؛ ذرة هالوجين؛ مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي؛ مجموعة فينوكسي؛ مجموعة أسيل أوكسي RCOO حيث تعبر R بدورها عن مجموعة A، مجموعة C_1-C_4 ألكيل أو مجموعة فينيل بها استبدال اختياري بمجموعات C_1-C_4 ألكيل، مجموعات C_1-C_4 هالو ألكيل، ذرات هالوجين.

تم وصف ظروف التفاعل التي تؤثر على العملية الموضحة أعلاه، حيث يتفاعل حمض أو أحد الهاليدات، أو الإسترات، أو الأنهيدريدات الخاصة به (مختلطة على نحو محتمل) مع أمين، بصورة كبيرة في المراجع الكيميائية، على سبيل المثال في "Advanced Organic Chemistry", Jerry March, 4th Edition, 1992, John Wiley & Sons Pub.، الصفحات 417- 424 والمراجع الموضحة فيها.

يمكن اختيار ظروف بديلة متنوعة، بالاعتماد أيضاً على طبيعة المركب ذي الصيغة (II)؛ على سبيل المثال، عندما تعبر X عن ذرة هالوجين، ويفضل الكلور، يتم التفاعل بصورة طبيعية في وجود مذيب خامل وفي وجود قاعدة عضوية أو غير عضوية، عند درجة حرارة تتراوح من – 20 درجة مئوية إلى نقطة غليان خليط التفاعل.

تتضمن أمثلة المذيبات التي يمكن استخدامها للتفاعل السابق الماء، أو هيدروكربونات أليفاتية أو أليفاتية حلقية (إيثر بترول، هكسان، سايكلو هكسان)، هيدروكربونات معالَجة بالكلور (كلوريد ميثيلين، كلوروفورم، تيترا كلوريد كربون، داي كلورو إيثان، وما إلى ذلك)، وهيدروكربونات أروماتية (بنزين، تولوين، زايلين، كلورو

بنزين، وما إلى ذلك)، وإيثرات (إيثر داي إيثيل، إيثر داي أيزو بروبيل، داي ميثوكسي إيثان، دايوكسان، تيترا هيدروفيوران، وما إلى ذلك)، وإسترات (أسيتات الإيثيل وما إلى ذلك)، وكيتونات (أسيتون، ميثيل إيثيل كيتون، ميثيل بروبيل كيتون، ميثيل أيزو بيوتيل كيتون، وما إلى ذلك)، ومركبات نيتريل (أسيتونيتريل، بنزونيتريل، وما إلى ذلك)، ومذيبات ثنائية القطبية لا بروتونية (داي ميثيل فورماميد، داي ميثيل أسيتاميد، هكسا ميثيل فوسفورو تراي أميد، داي ميثيل سلفوكسيد، سلفولان، N- ميثيل بيروليدون، وما إلى ذلك).

وتكون القواعد غير العضوية التي يمكن استخدامها لهذا الغرض، هي على سبيل المثال، هيدروكسيدات، كربونات وبيكربونات الصوديوم أو البوتاسيوم.

وتكون القواعد العضوية التي يمكن استخدامها لهذا الغرض هي، على سبيل المثال، تراي إيثيل أمين، بيريدين، 4- N، N –داي ميثيل- أمينو بيريدين، N، N – داي ميثيل أنيلين، N- ميثيل- ببريدين، لوتيدين، داي آزا باي سايكلو- أوكتان (DABCO)، داي آزا باي سايكلو نونين (DBN)، داي آزا باي سايكلو أونديسين (DBU).

يمكن على أي حال، تحضير المركبات الوسيطة ذات الصيغة العامة (II) و(III)، عندما لا يكون قد تم وصفها بالفعل في المراجع، بواسطة تهيئة الطرق التخليقية المعروفة جيداً للخبراء في المجال.

على سبيل المثال، يمكن تحضير أحماض بيارزول كربوكسيليك [الصيغة (II) حيث A_1 =A، OH =X] وفقاً لما تم وصفه في براءة الاختراع الأمريكية US 5,093,347؛ يمكن تحضير أحماض ثيازول كربوكسيليك [الصيغة (II) حيث A_2 =A، OH =X] وفقاً لما تم وصفه في براءة الاختراع DE 10250110؛ ويمكن تحضير أحماض بيريميدين كربوكسيليك [الصيغة (II) حيث A_4 =A، OH =X] وفقاً لما تم وصفه في براءة الاختراع الأوروبية EP 569912.

يمكن تحضير مشتقات الحمض المناظرة (إسترات، أنهيدريدات، هاليدات) بسهولة من تلك التي تم وصفها على سبيل المثال، في "Advanced Organic Chemistry", Jerry March النسخة الرابعة، 1992، و .John Wiley & Sons Pub، الصفحات 392-402، 437 - 438 والمراجع المذكورة فيها.

كما ذكر بالفعل، يكون للمركبات ذات الصيغة العامة (I) نشاط مبيد للفطريات عالي جداً والذي يُبذل فيما يتعلق بفطريات متنوعة مُمرِضة للنباتات والتي تهاجم محاصيل زراعية هامة.

ومن ثم يهدف الاختراع الحالي أيضًا إلى استخدام المركبات ذات الصيغة العامة (I) للسيطرة على الفطريات المُمرِضة للنبات بالمحاصيل الزراعية.

وأمثلة الفطريات المُمرِضة للنباتات التي يمكن محاربتها بفعالية باستخدام مركبات الصيغة العامة (I) الخاصة بالاختراع الحالي، هي تلك التي تنتمي إلى مجموعات الفطريات الدُعامية، الفُطْرِيَّاتُ الزِّقِّيَّة، الفطريات الناقصة أو الفطريات غير الكاملة، الفطريات البيضية؛ فصائل: Puccinia spp.؛ السوَّادية، النَّخْرِيَّة، Uromyces spp.، spp. الفَقَاقَة، Rhizoctonia spp.، Phakopsora spp.، Sphaerotheca spp.، Podosphaera spp.، Uncinula spp.، Helminthosporium spp.، Rhynchosporium spp.، Pyrenophora spp.، Monilinia spp.، الصليباء، Septoria spp. (Mycosphaerella spp.)، Venturia spp.، المُعَنْقَدَة، النوباء، المغزلاوية، مذنبة الأبواغ، Cercosporella herpotrichoides، Colletotrichum spp.، Pyricularia oryzae، الأصلوبة، Phytophtora spp.، Pythium spp.، Plasmopara viticola، Peronospora spp.، Pseudoperonospora cubensis، Bremia lactucae.

تشتمل المحاصيل الرئيسية التي يمكن حمايتها باستخدام مركبات الاختراع الحالي، على حبوب (قمح، شعير، الشيلم، الشوفان، الأرز، الذرة، عصير الذرة السكرية، وما إلى ذلك)، وأشجار الفاكهة (التفاح، الكمثرى، البرقوق، الخوخ، اللوز، الكريز، الموز، الكروم، الفراولة، التوت، التوت الأسود، وما إلى ذلك)، وأشجار الحوامض (البرتقال، الليمون، واليوسفي، والجريب فروت، وما إلى ذلك)، والبقل (الفول، والبازلاء، والعدس، وفول الصويا، وما إلى ذلك)، والخضروات (السبانخ، والخس، الهليون، الكرنب، والجزر، والبصل، والطماطم، والبطاطس، والباذنجان، والفلفل، وما إلى ذلك)، وأنواع القرع (اليقطين، والقرع الصيفي، والخيار، والشمام، والبطيخ، وما إلى ذلك)، وبذور الزيت (عباد الشمس، اللفت، الفول السوداني، ونبات زيت الخروع، وجوز الهند، وما إلى ذلك)، والتبغ، والقهوة، الشاي، والكاكاو، وبنجر السكر، وقصب السكر، والقطن.

على وجه الخصوص، أثبتت المركبات ذات الصيغة العامة (I) أنها فعالة بصورة كبيرة في السيطرة على Plasmopara viticola على الكروم، Phytophtora infestans والعنقودية الرمادية على الطماطم، Puccinia recondita، الفقاقة جرامينيس، Helminthosporium teres، Septoria nodorum، وفصائل المغزلاوية، على الحبوب؛ في السيطرة على Phakopsora pachyrhizi على الصويا؛ وفي السيطرة على Uromyces appendiculatus على الفول؛ وفي السيطرة على Venturia inaequalis على التفاح، وفي السيطرة على Sphaeroteca fuliginea على الخيار.

علاوة على ذلك، تكون المركبات ذات الصيغة العامة (I) فعالة أيضاً في السيطرة على البكتيريا والفيروسات المُمرِضة للنبات، مثل على سبيل المثال، فصائل المستصفرة، والزائفة، والإيروينية أميلوفورا، والفيروس المُزيق بالتبغ.

تتمكن المركبات ذات الصيغة العامة (I) من بذل نشاط مبيد للفطريات في كل من التطبيقات العلاجية والوقائية ولها سُميَّة نباتية منخفضة جداً أو معدومة على المحاصيل الخاضعة المعالجة.

للاستخدامات العملية في الزراعة، عادة ما يفضل استخدام تركيبات مبيدة للفطريات تحتوي على مركبات لها الصيغة (I) وفقاً للاختراع الحالي، والتي تتم صياغتها بصورة ملائمة.

كما يرتبط هدف آخر للاختراع الحالي بتركيبات مبيدة للفطريات تشتمل على واحد أو أكثر من المركبات ذات الصيغة (I)، مذيب و/ أو مادة مخففة صلبة أو سائلة، على نحو محتمل مادة خافضة للتوتر السطحي.

يمكن أن تكون التركيبات المبيدة للفطريات السابقة في صورة مساحيق جافة، ومساحيق قابلة للترطيب، ونواتج تركيز قابلة للاستحلاب، ومستحلبات، ومستحلبات دقيقة، وعجائن، وحبيبات، وحبيبات قابلة للتشتت في الماء، ومحاليل، ومعلقات، وما إلى ذلك؛ ويعتمد اختيار نوع التركيبة على الاستخدام الخاص.

يتم تحضير التركيبات المبيدة للفطريات بطريقة معروفة، على سبيل المثال عن طريق تخفيف أو إذابة المادة الفعالة بواسطة وسط مذيب و/ أو مادة مخففة صلبة أو سائلة، وعلى نحو محتمل في وجود المواد الخافضة للتوتر السطحي.

وتكون المواد المخففة الصلبة أو المواد الحاملة التي يمكن استخدامها على سبيل المثال هي: السيليكا، الكاولين، البنتونيت، التلك، تراب دياتومي، دولوميت، كربونات الكالسيوم، المجنسيا، الجبس، الطمي، والسيليكات التخليقية، والأتابولجيت، والسيبيوليت.

وتكون المذيبات أو المواد المخففة السائلة التي يمكن استخدامها، على سبيل المثال بالإضافة إلى الماء، المذيبات العضوية الأروماتية (مركبات زايلول أو خلائط من ألكيل بنزولات، كلورو بنزين، وما إلى ذلك)، بارافينات (أجزاء بترول)، كحولات (ميثانول، بروبانول، بيوتانول، أوكتانول، جليسرين، وما إلى ذلك)، وإسترات (أسيتات الإيثيل، أيزو بيوتيل أسيتات، كربونات الألكيل، إسترات الألكيل لحمض أديبيك، وإسترات ألكيل لحمض جلوتاريك، وإسترات ألكيل لحمض سكسينيك، وإسترات ألكيل لحمض لاكتيك، وما إلى ذلك)، وزيوت نباتية (زيت اللفت، زيت عباد الشمس، زيت فول الصويا، زيت الخروع، زيت الذرة، زيت الفول السوداني، وإسترات ألكيل الخاصة بها)، وكيتونات (سايكلو هكسانون، أسيتون، أسيتوفينون، أيزو فورون، إيثيل أميل كيتون، وما إلى ذلك)، وأميدات (N,N- داي ميثيل فورماميد، N- ميثيل بيروليدون، وما إلى ذلك)، وسلفوكسيدات وسلفونات (داي ميثيل سلفوكسيد، داي ميثيل سلفون، وما إلى ذلك)، وخلائط منها.

يمكن استخدام أملاح الصوديوم، وأملاح الكالسيوم، وأملاح البوتاسيوم، وأملاح تراي إيثيل أمين أو تراي إيثانول أمين لألكيل نفثالين سلفونات، بولي نفثالين سلفونات، ألكيل سلفونات، أريل سلفونات، ألكيل أريل سلفونات، بولي كربوكسيلات، سلفوسكسينات، ألكيل سلفو سكسينات، سلفونات لجنين، سلفات ألكيل، كمواد خافضة للتوتر السطحي؛ وأيضاً ككحولات دهنية معالَجة ببولي إيثوكسيل، وألكيل فينولات معالَجة ببولي إيثوكسيل، وإسترات سوربيتول معالَجة ببولي إيثوكسيل، وبولي بروبوكسي بولي إيثوكسيلات (بوليمرات حجمية).

كما يمكن أن تحتوي التركيبات المبيدة للفطريات على مواد مضافة خاصة لأغراض محددة، مثل على سبيل المثال، عوامل مضادة للتجميد مثل بروبيلين جلايكول، أو عوامل التصاق، مثل الصمغ العربي، وكحول بولي ڤينيل، وبولي ڤينيل بيروليدون، وما إلى ذلك.

عند الحاجة، يمكن إضافة مبادئ فعالة متوافقة أخرى إلى التركيبات المبيدة للفطريات التي تحتوي على المركبات ذات الصيغة (I)، مثل، على سبيل المثال، مبيدات

فطرية مختلفة عن تلك ذات الصيغة العامة (I)، عوامل تنظيم للنبات، مضادات حيوية، مبيدات الأعشاب، مبيدات الحشرات، المخصِّبات و/ أو خلائط منها.

وتكون أمثلة مبيدات الفطريات المختلفة عن تلك ذات الصيغة العامة (I)، التي يمكن تضمينها في التركيبات المبيدة للفطريات التي تمثل الهدف من الاختراع الحالي:

أسيبينزولار، أميتوكترادين، أميسولبروم، أمبروبيلفوس، أنيلازين، آزاكونازول، آزوكسيستروبين، بينالاكسيل، بينالاكسيل-M، بينوميل، بنثياڤاليكارب، بايتيرتانول، بيكسافين، بلاستيسيدين- S، بوزكاليد، بروموكونازول، بيوبيريمات، بوثيوبات، كابتافول، كابتان، كاربيندازيم، كاربوكسين، كاربروباميد، كينوميثيونات، كلورونيب، كلوروثالونيل، كلوزولينات، سيازوفاميد، سيفلوفيناميد، سيموكسانيل، سيبروكونازول، سيبرودينيل، ديباكارب، دايكلوفلوانيد، دايكلون، دايكلوبيوترازول، دايكلوميزين، دايكلوران، دايكلوسيميت، داي إيثوفينكارب، دايفينوكونازول، دايفلوميتوريم، دايمثيريمول، دايميثومورف، دايموكسيستروبين، داينيكونازول، داينوكاب، دايبيريثيون، دايتاليموفوس، دايثيانون، دوديمورف، دوداين، إيديفينفوس، إيبوكسيكونازول، إيتاكونازول، إيثابوكسام، إيثيريمول، إيثوكسيكوين، إيتريديازول، فاموكسادون، فيناميدون، فينامينوسولف، فينابانيل، فيناريمول، فينبوكونازول، فينفيورام، فينهكساميد، فينوكسانيل، فينبيكلونيل، فينبروبيدين، فينبروبيومورف، فينتين، فيربام، فيريمزون، فلوازينام، فلوديوكسونيل، فلوميتوڤير، فلومورف، فلوبيكوليد، فلوبيرام، فلوروإيميد، فلوتريمازول، فلوكساستروبين، فلوكوينكونازول، فلوسيلازول، فلوسولفاميد، فلوتيانيل، فلوتولانيل، فلوتريافول، فولبيت، فوسيتيل- ألومنيوم، فوبيريدازول، فيورالاكسيل، فيوراميتبير، فيوركونازول، فيوركونازول-سيس، جوازاتين، هكساكونازول، هيميكسازول، إيدروسيكينولينا سولفاتو، إيمازاليل، إيميبينكونازول، إيمينوكتادين، إيبكونازول، إيبروبينفوس، إيبرودايون، أيزوبروثيولان، أيبروڤاليكارب، أيزوبيرازام، أيزوتيانيل، كاسوجامايسين، كريسوكسيم- ميثيل، مانكوبر، مانكوزيب، مانديبروباميد، مانيب، ميبينيل، ميبانيبيريم، ميبرونيل، ميبتيل دينوكاب، ميتالاكسيل، ميتالاكسيل- M، ميتكونازول، ميثفيوروكسام، ميتيرام، ميتومينوستروبين، ميترافينون، ميتسولفوڤاكس، مايكلوبيوتانيل، ناتامايسين، نيكوبيفين، نيتروثال أيزوبروبيل، نواريمول، أوفوراس، أوريساستروبين، أوكسا ديكسيل، أوكسبوكونازول، أوكسي

كربوكسين، بيفيورازوات، بينكونازول، بنسيكورون، بينفلوفين، بنتا كلورو فينول وأملاحها، بنثيوبيراد، فثاليد، بيكوكسيستروبين، بيبرالين، خليط بوردو، بولي أوكسينات، بروبينازول، بروكلوراز، بروسيميدون، بروباموكارب، بروبيوكونازول، بروبينيب، بروكوينازيد، بروثيوكارب، بروثيوكونازول، بيراكاربوليد، بيراكلوستروبين، بيراميتوستروبين، بيراأوكسي ستروبين، بيرازوفوس، بيريبينكارب، بيريفينوكس، بيريميثانيل، بيروكويلون، بيروكسيفور، كويناسيتول، كويناز اميد، كوينكونازول، كوينوكسيفين، كوينتوزين، رابينزازول، هيدروكسيد النحاس، أوكسي كلوريد النحاس، أكسيد النحاس (I)، سلفات النحاس، سيداكسان، سيلثيوفام، سايميكونازول، سبيروكسامين، ستريبتومايسين، تيبوكونازول، تيتراكونازول، ثيابندازول، ثيادايفلورو، ثيسيوفين، ثيفلوزاميد، ثيوفانات، ثيوفانات- ميثيل، ثيرام، تيادينيل، تيوكسيميد، تولكلوفوس- ميثيل، توليل فلوانيد، تراي أديميفون، تراي أديمينول، تراي أريمول، تراي آزبوتيل، تراي آزوكسيد، تراي سايكلو آزول، تراي ديمورف، تراي فلوكسي ستروبين، تراي فلوميزول، ترايفورين، ترايتيكونازول، أونيكونازول، أونيكونازول- P، ڤاليدامايسين، ڤاليفينالات، ڤينكلوزولين، زينيب، زيرام، سلفر، زوكساميد.

يمكن أن يختلف تركيز المركبات ذات الصيغة العامة (I) في التركيبات السابقة ضمن نطاق واسع؛ وهو يتراوح بشكل عام من 1% إلى 90%، ويفضل من 5% إلى 50%.

يمكن تفعيل تطبيق تلك التركيبات على كل جزء من النبات، على سبيل المثال، على الأوراق، السيقان، الفروع والجذور، أو على البذور نفسها قبل نثر البذور، أو على الأرض التي ينمو عليها النبات.

كما أن هناك هدف آخر للاختراع يتمثل في طريقة للسيطرة على الفطريات المُمرِضة للنبات في المحاصيل الزراعية، حيث تتكون من استخدام جرعات فعالة من المركبات ذات الصيغة (I)، المستخدمة كما هي أو تتم صياغتها في تركيبات مبيدة للفطريات كما تم الوصف سابقاً.

يمكن أن تختلف كمية المركب المستخدم للحصول على التأثير المطلوب فيما يتعلق بعوامل مختلفة، مثل على سبيل المثال، المركب المستخدم، والمحاصيل المراد حفظها، ونوع مُسبب المرض، ودرجة العدوى، والظروف الجوية، وطريقة الاستخدام، والصيغة المتبَّعة.

توفر جرعات المركب التي تتراوح من 10 جم إلى 5 كجم لكل هكتار من المحاصيل الزراعية بشكل عام سيطرة كافية.

يتم تقديم الأمثلة التالية للوصول إلى فهم أفضل للاختراع لأغراض توضيحية وغير مقيدة له.

المثال 1

تحضير 3- داي فلورو ميثيل- N- (7- فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4- إندانيل)-1- ميثيل-4- بيرازول كربوكساميد (المركب N. 1)

تم إسقاط 0.4 ملليلتر من تراي إيثيل أمين إلى محلول من 7- فلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-أمينو إندان (0.45 جرام) و3- (داي فلورو ميثيل)-1- ميثيل – 1H- بيرازول-4- كربونيل كلوريد (0.44 جرام) في 8 ملليلتر من داي كلورو ميثان.

بعد الحفظ مع التقليب لمدة 8 ساعات عند درجة حرارة الغرفة، تمت إضافة حمض هيدروكلوريك مخفف إلى خليط التفاعل، وتم فصل الأطوار وتم استخلاص الطور المائي باستخدام داي كلورو ميثان.

بعد ذلك تم ربط الأطوار العضوية، ومعالجتها بأنهيدريد باستخدام سلفات الصوديوم وتم التركيز عند ضغط منخفض.

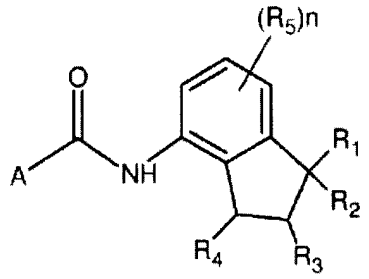
بعد ذلك، تمت تنقية المنتج الخام الذي تم الحصول عليه على عمود هلام سيليكا (مادة التصفية التتابعية هكسان/ أسيتات الإيثيل 8/ 2) لإنتاج 0.45 جم من المنتج المطلوب، وهو مادة صلبة بيضاء مع نقطة صهر 147 درجة مئوية.

^{1}H NMR (200 Mhz, $CDCl_3$) δ a : 1.43 (3H, d), 1.38 (3H, s), 1.44, (3H, s), 1.66 (1H, dd) , 2.21 (1H, dd), 3.38 (1H m), 3.98(3H,s),6.81 (1H,bs), 6.95 (1H,t), 6.70 (1H m), 7.81 (1H,bs), 8.03 (1H,bs)

المثال 2

تحضير المركبات رقم 2- 9

بصورة مماثلة للإجراء الموضح بالمثال 1، تم تحضير المركبات ذات الصيغة العامة (I) الموضحة في الجدول 1.



(I)

الجدول 1

R_5	R_4	R_3	R_2	R_1	A	المركب رقم
7-F	Me	H	Et	Et	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4- بيرازوليل	2
7-OMe	Me	H	Me	Me	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4- بيرازوليل	3
7-F	Me	H	Me	Me	4- داي فلورو ميثيل-2- ميثيل-5- ثيازوليل	4
7-Me	Me	H	Me	Me	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4- بيرازوليل	5
7-Cl	Me	H	Me	Me	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4- بيرازوليل	6
7-OCF_3	Me	H	Me	Me	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4- بيرازوليل	7
7-SMe	Me	H	Me	Me	3- داي فلورو ميثيل-1- ميثيل-4-	8

	بيرازوليل					

نقاط الصهر:

رقم 2: 115 درجة مئوية؛ رقم 3: 110 درجة مئوية؛ رقم 4: 95 درجة مئوية؛ رقم 6: 140 درجة مئوية؛ رقم 7: 105 درجة مئوية؛ رقم 8: 97 درجة مئوية.

المثال 3

تحديد النشاط المضاد للفطريات في تطبيق وقائي (5 أيام) ضد الفقاقة جرامينيس على القمح.

تمت معالجة أوراق نباتات القمح من مجموعة Salgemma، التي تنمو في قدور في بيئة تمت تهيئتها عند 20 درجة مئوية و70% من الرطوبة النسبية (.R.H)، بواسطة رش المركبات الخاضعة للفحص على جانبي الأوراق، وتكون مشتتة في محاليل أسيتون مائية عند 20% بالحجم من الأسيتون.

بعد البقاء لمدة 5 أيام في بيئة تمت تهيئتها، تم نقل العدوى إلى النباتات تحت ظروف جافة بواسطة الرج عليها، لتوزيع اللقيحة، نباتات تم نقل عدوى الفقاقة جرامينيس إليها مسبقاً.

بعد ذلك تم إبقاء النباتات في نفس الخلية، في بيئة مشبعة بالرطوبة وعند درجة حرارة تتراوح من 18 إلى 24 درجة مئوية لمدة 12 يوم.

في نهاية هذه الفترة، ظهرت الأعراض الخارجية لمُسبِب المرض ولهذا كان من الممكن الاستمرار في تقييم شدة العدوى، على الجزأين المعالَجين مباشرة باستخدام المنتجات (T)، وأيضاً على أجزاء تطوَّرت أثناء الاختبار (NT)، بواسطة مقياس تقييم نسبة مئوية ملحوظ لمساحة الأوراق المصابة؛ ويشتمل المقياس، كنهايات طرفية، القيمة 100 (نبات بدون عيوب) والقيمة صفر (نبات مصاب بالكامل).

في نفس الوقت، تم تقييم السُميَّة النباتية (النسبة المئوية لتنكرز الورق) المستحثة على نباتات القمح بواسطة استخدام المنتجات؛ في هذه الحالة، يتراوح مقياس التقييم من صفر (نبات سليم بالكامل) إلى 100 (نبات متنكرز بالكامل).

يوضح الجدول 2 النتائج التي تم الحصول عليها عن طريق تنفيذ الاختبار الذي تم وصفه بواسطة المركب رقم 1، مقارنة بالمنتجات المرجعية التالية التي تم وصفها في المجال السابق:

RC1: 3- داي فلورو ميثيل-1-ميثيل-N- (1،1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4- بيرازول كربوكساميد من براءة الاختراع الأمريكية US 5,093,347؛

RC2: 1، 5- داي ميثيل-3- تراي فلورو -ميثيل-N- (1، 1- داي ميثيل-7-فلورو -4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد [براءة الاختراع الأوروبية EP199822، الصفحة 15، السطور 19- 20]؛

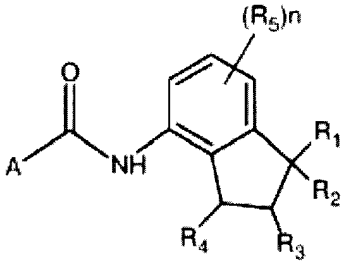
RC3: 1، 3، 5- تراي ميثيل-N- (1، 1- داي ميثيل-5-فلورو -4-إندانيل) -4- بيرازول كربوكساميد [براءة الاختراع الأوروبية EP199822، المركب (4)].

الجدول 2. النشاط المبيد للفطريات الوقائي (5 أيام) ضد الفقاقة جرامينيس على القمح.

المركب	**الجرعة** (جزء في المليون)	**النشاط NT /T**	**السُميَّة النباتية**
رقم 1	125	90 /95	صفر
CR-1	125	65 /70	10
CR-2	125	15/25	صفر
CR-3	125	10/ صفر	صفر

عناصر الحماية

1- مركبات أمينو إندان أميد لها الصيغة البنائية (I):



(I)

حيث:

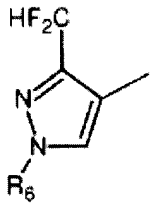
- R_1، وR_2، و R_4، تكون مساوية أو مختلفة عن بعضها البعض، وتعبر عن مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، يمكن أن ترتبط المجموعتين R_1 وR_2 على نحو محتمل لتكوين مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل تم تكثيفها بمجموعة سبيرو باستخدام إندانيل؛

- R_3 تعبر عن ذرة هيدروجين، مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل؛

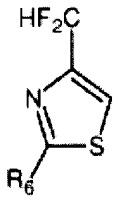
- R_5 تعبر عن ذرة هالوجين، مجموعة C_1-C_4 ألكيل، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو؛

- n تعبر عن عدد صحيح يتراوح من 1 إلى 3؛

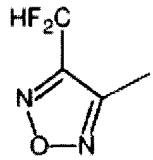
- A تعبر عن واحدة من الحلقات غير المتجانسة التالية A_1 - A_5:



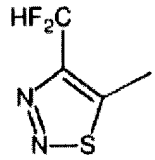
A_1



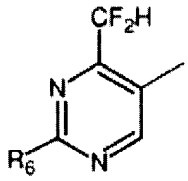
A_2



A_3



A_4



A_5

- R_6 هي مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو.

2- المركبات وفقاً لعنصر الحماية 1، حيث تتميز بأنه في الصيغة (I)، تعبر A عن A_1، R_1، R_2، R_4 و R_6هي مجموعة ميثيل، R_3 هي ذرة هيدروجين، وتعبر R_5 عن هالوجين.

3- المركبات وفقاً لعنصر الحماية 1، حيث يتم اختيارها من المركبات التالية ذات الصيغة (I):

3- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو -1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -1-ميثيل-4-بيرازول كربوكساميد؛

4- داي فلورو ميثيل-N- (7-فلورو -1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -2-ميثيل-5-ثيازول كربوكساميد؛

3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (1 ،1 ،3، 7-تيترا ميثيل-4-إندانيل) -بيرازول كربوكساميد؛

3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7-ميثوكسي-1، 1، 3- تراي ميثيل- 4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7-ميثيل ثيو-1 ،1 ،3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

3- داي فلورو ميثيل -1-ميثيل-N- (7- تراي فلورو ميثوكسي-1 ،1 ،3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -4-بيرازول كربوكساميد؛

3- داي فلورو ميثيل-N- (7-كلورو-1، 1، 3- تراي ميثيل-4-إندانيل) -1-ميثيل-4-بيرازول كربوكساميد؛

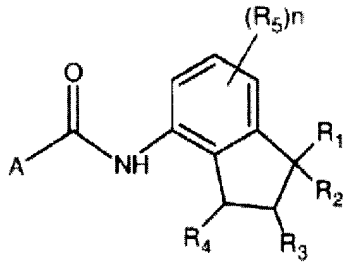
4- المركبات وفقاً لعنصر الحماية 1، حيث تتميز بأنها تكون في صورة خلائط راسيمية، خلائط مزدوجة التجاسم، وخلائط منفصلة جزئياً، أيزومرات ضوئية منفردة و/ أو مزدوجات تجاسم منفردة.

5- تركيبات مبيدة للفطريات تشتمل على واحد أو أكثر من المركبات ذات الصيغة (I) وفقاً لأي من عناصر الحماية من 1 إلى 4، ومذيب و/ أو مادة مخففة صلبة أو سائلة، على نحو محتمل مادة خافضة للتوتر السطحي.

6- التركيبات وفقاً لعنصر الحماية 5، وتشتمل أيضاً على مبادئ فعالة متوافقة مع المركبات ذات الصيغة العامة (I)، ويتم اختيارها من مبيدات الفطريات المختلفة عن المركبات ذات الصيغة العامة (I)، عوامل تنظيم للنبات، مضادات حيوية، مبيدات الأعشاب، مبيدات الحشرات، المخصِّبات و/ أو خلائط منها، وعوامل مضادة للتجميد، وعوامل التصاق.

7- التركيبات وفقاً لعنصر الحماية 5 أو 6، حيث يتراوح تركيز المركبات ذات الصيغة العامة (I) من 1 إلى 90% بالوزن فيما يتعلق بإجمالي وزن التركيبة، ويفضل من 5 إلى 50% بالوزن فيما يتعلق بإجمالي وزن التركيبة.

8- استخدام أمينو إندان أميدات لها الصيغة البنائية (I):



(I)

حيث:

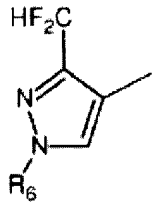
- R_1، وR_2، و R_4، تكون مساوية أو مختلفة عن بعضها البعض، وتعبر عن مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، يمكن أن ترتبط المجموعتين R_1 وR_2 على نحو محتمل لتكوين مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل تم تكثيفها بمجموعة سبيرو باستخدام إندانيل؛

- R_3 تعبر عن ذرة هيدروجين، مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل؛

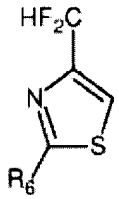
- R_5 تعبر عن ذرة هالوجين، مجموعة C_1-C_4 ألكيل، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو؛

- n تعبر عن عدد صحيح يتراوح من 1 إلى 3؛

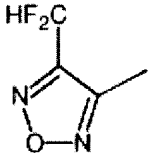
- A تعبر عن واحدة من الحلقات غير المتجانسة التالية A_1 – A_5:



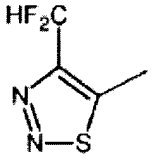
A_1



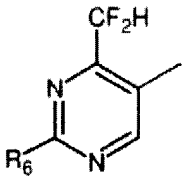
A_2



A_3



A_4



A_5

- R_6 هي مجموعة C_1-C_3 ألكيل، مجموعة C_1-C_3 هالو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 سايكلو ألكيل، مجموعة C_3-C_6 هالو سايكلو ألكيل، مجموعة C_1-C_4 ألكوكسي، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكوكسي، مجموعة SH، مجموعة C_1-C_4 ألكيل ثيو، مجموعة C_1-C_4 هالو ألكيل ثيو،

للسيطرة على فطريات مُمرِضة للنباتات بمحاصيل زراعية.

9- استخدام المركبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 2- 4 للسيطرة على فطريات مُمرِضة للنباتات بمحاصيل زراعية.

10- استخدام تركيبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 5- 7 للسيطرة على فطريات مُمرِضة للنباتات بمحاصيل زراعية.

11- استخدام التركيبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 8 إلى 10 للسيطرة على فطريات مُمرِضة للنباتات تنتمي إلى مجموعة الفطريات الدُعامية، الفُطْرِيَّاتُ الزِّقِّيَّة، الفطريات الناقصة أو الفطريات غير الكاملة، الفطريات البيضية؛ فصائل: Puccinia spp.؛ السوَّادية، النَّخْرِيَّة، Uromyces spp.، Phakopsora spp.، Rhizoctonia spp.، الفَقاقَة، Sphaerotheca spp.، Podosphaera spp.، Uncinula spp.، Helminthosporium spp.، Rhynchosporium، Pyrenophora spp.، Monilinia spp.، الصليباء، (Mycosphaerella spp.) Septoria spp.، Venturia spp.، المُعَنْقَدَة، النوباء، المغزلاوية، مذنبة الأبواغ، Cercosporella herpotrichoides، Colletotrichum spp.، Pyricularia oryzae، الأصلوبة، Phytophtora spp.، Pythium spp.، Plasmopara viticola، Peronospora spp.، Pseudoperonospora cubensis، Bremia lactucae.

12- استخدام وفقاً لأي من عناصر الحماية 8 إلى 10، حيث تكون المحاصيل الزراعية هي الحبوب، وأشجار الفاكهة، وأشجار الحوامض، والبقل، والمحاصيل المتعلقة بالبستنة، والقرع، والنبات الزيتية، والتبغ، والقهوة، والشاي، والكاكاو، وبنجر السكر، وقصب السكر، والقطن.

13- استخدام وفقاً لأي من عناصر الحماية من 8 إلى 10 للسيطرة على Plasmopara viticola على الكروم، وPhytophtora infestans والعنقودية الرمادية على الطماطم، Puccinia recondita، والفقاقة جرامينيس، Helminthosporium teres، Septoria nodorum، وفصائل المغزلاوية، على الحبوب؛ و Phakopsora pachyrhizi على الصويا؛ وUromyces appendiculatus على الفول؛ و Venturia inaequalis على التفاح، وSphaeroteca fuliginea على الخيار.

14- استخدام المركبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 1- 4 أو تركيبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 5 إلى 7 للسيطرة على البكتيريا أو الفيروسات المُمرِضة للنبات.

15- طريقة للسيطرة على الفطريات المُمرِضة للنبات في المحاصيل الزراعية، وتتكون من استخدام جرعات فعالة من المركبات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 1- 4 أو تركيبات مبيدات فطريات وفقاً لأي من عناصر الحماية من 5 إلى 7، بكميات تتراوح من 10 جم إلى 5 كجم من المركب ذي الصيغة (I) لكل هكتار من المحصول الزراعي.