



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 156 235** ⁽¹³⁾ **C2**
 (51) МПК⁷ **C 07 C 233/51, 231/02, 255/24, 255/31, A 01 N 37/18, 37/34**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
 ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 97121852/04, 29.05.1996
 (24) Дата начала действия патента: 29.05.1996
 (30) Приоритет: 31.05.1995 JP 7/157000
 (46) Дата публикации: 20.09.2000
 (56) Ссылки: US 4001427 A, 04.01.1977. US 5186737 A, 16.02.1993. DE 3704100 A1, 18.08.1988. DE 4236400 A1, 05.05.1994. WO 9501358 A, 12.01.1995. DE 4326909 A1, 05.05.1994. SU 1170969 A, 30.07.1985. SU 790622 A, 30.11.1983. Справочник по пестицидам. - М.: Химия, 1985, с. 264-265.
 (85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 31.12.1997
 (86) Заявка РСТ: JP 96/01419 (29.05.1996)
 (87) Публикация РСТ: WO 96/38406 (05.12.1996)
 (98) Адрес для переписки: 129010, Москва, ул. Большая Спасская 25, стр.3, ООО "Городисский и Партнеры", Лебедевой Н.Г.

(71) Заявитель: КУМИЙ КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP), ИХАРА КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP)
 (72) Изобретатель: Кацуми МАСУДА (JP), Икуми УРУСИБАТА (JP), Цуеси АСАХАРА (JP), Кацуми ФУРУСЕ (JP), Есиюки КОДЗИМА (JP), Хироси АБЕ (JP)
 (73) Патентообладатель: КУМИЙ КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP), ИХАРА КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО., ЛТД. (JP)

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ФЕНИЛАЛКАНАМИДА, СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫЙ ИЛИ САДОВЫЙ ФУНГИЦИД

(57) Описываются новые производные фенилалканамида, представленные формулой 1, где R¹ означает атом водорода или C₁-C₆ алкильную группу, R² означает атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, R³ и R⁴ каждый независимо представляет C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ циклоалкильную группу, C₂-C₆ алкоксильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклоалкильную группу 5-7-членного цикла, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, Q представляет цианогруппу или группу формулы -COR⁵, где R⁵ означает гидроксигруппу, C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу или

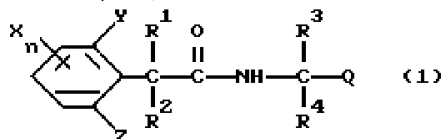
C₁-C₆ диалкиламиногруппу, X означает атом галогена, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, гидроксигруппу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкоксигруппу, C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, арилоксигруппу, гетероарилоксигруппу, выбранную из пиридилокси и тиенилокси, C₁-C₆ алкилтиогруппу, C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу, C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу, циано, арильную группу, гетероарильную группу, выбранную из пиридила или пирролила, алкилкарбонильную группу, арилкарбонильную группу, тиенилкарбонильную группу, каждый из E и Z независимо представляет атом водорода или атом галогена, n равно целому числу 0-3,

RU 2 156 235 C2

RU 2 156 235 C2

исключая случай, когда R³ и R⁴ представляют трифторметильную группу одновременно, и при условии, что, когда R¹ и R² оба представляют водород, оба Y и Z представляют атом водорода и n представляет целое число 1-3. Соединения формулы 1 проявляют превосходящую фунгицидную активность по сравнению с обычными фунгицидами по отношению к перкуляриозу риса и подобным

заболеваниям и в то же время не мешают росту желательных растений. Описывается способ их получения и с/х или садовые фунгициды на основе указанных соединений. 4 с. и 4 з.п. ф-лы, 32 табл.



RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU ? 1 5 6 2 3 5 C 2



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 156 235** ⁽¹³⁾ **C2**
 (51) Int. Cl.⁷ **C 07 C 233/51, 231/02,**
255/24, 255/31, A 01 N 37/18, 37/34

RUSSIAN AGENCY
 FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

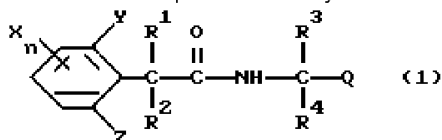
(21), (22) Application: 97121852/04, 29.05.1996
 (24) Effective date for property rights: 29.05.1996
 (30) Priority: 31.05.1995 JP 7/157000
 (46) Date of publication: 20.09.2000
 (85) Commencement of national phase: 31.12.1997
 (86) PCT application:
 JP 96/01419 (29.05.1996)
 (87) PCT publication:
 WO 96/38406 (05.12.1996)
 (98) Mail address:
 129010, Moskva, ul. Bol'shaja Spasskaja 25,
 str.3, OOO "Gorodisskij i Partnery", Lebedevoj N.G.

(71) Applicant:
 KUMIAJ KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP),
 IKhARA KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP)
 (72) Inventor: Katsumi MASUDA (JP),
 Ikumi URUSIBATA (JP), Tsuesi ASAKhARA
 (JP), Katsumi FURUSE (JP), Esijuki KODZIMA
 (JP), Khirosi ABE (JP)
 (73) Proprietor:
 KUMIAJ KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP),
 IKhARA KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP)

(54) **PHENYLALKANEAMIDE DERIVATIVES, METHODS OF PREPARATION THEREOF AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL FUNGICIDE**

(57) Abstract:

FIELD: chemical industry. SUBSTANCE: described are new phenylalkaneamide derivatives represented by formula I:



wherein R¹ is hydrogen atom or C₁-C₆ alkyl group; R² is hydrogen atom, C₁-C₆ alkyl group; R³ and R⁴ each independently is C₁-C₆ alkyl group, C₂-C₆ cycloalkyl group, C₂-C₆ alkoxy group, C₁-C₄ halogenalkyl group or R³ and R⁴ together with carbon atom to which they are attached, form 5-7 membered cycloalkyl cycle which is substituted by C₁-C₆ alkyl group; Q is cyano group or group of formula -COR⁵ wherein R⁵ is hydroxy group, C₁-C₆ alkyl group, C₁-C₆ alkoxy group, amino group, C₁-C₆ alkylamino group or C₁-C₆ dialkylamino group; X is halogen atom, C₁-C₆ alkyl group, C₂-C₆ alkynyl group, C₁-C₄ halogenalkyl group, hydroxy group, C₁-C₆ alkoxy group, C₃-C₆ cycloalkoxy

group, C₁-C₄ halogenalkoxy group, aryloxy group, heteroaryloxy group selected from pyridyloxy and thienyloxy, C₁-C₆ alkylthio group, C₁-C₆ alkylsulfinyl group, C₁-C₆ alkylsulfonyl group, amino group, C₁-C₆ alkylamino group, C₁-C₆ dialkylamino group, nitro group, cyano, aryl group, heteroaryl group selected from pyridyl or pyrrolyl, alkylcarbonyl group, aryl carbonyl group, thienylcarbonyl group; each from E and Z is independently hydrogen atom or halogen atom, n is integer of 0-3 except for the case when R³ and R⁴ are trifluoromethyl group simultaneously, and provided that then R¹ and R² are both hydrogen, both Y and Z are hydrogen atom, and n is integer of 1-3. Compounds of formula I have superb fungicidal activity as compared with conventional fungicides with respect to rice and similar diseases and at the same time do not interfere with growth of desired plants. Also described are method of preparing said plants and horticultural fungicides based on above-mentioned compounds. EFFECT: improved properties of the agricultural and horticultural fungicide and more efficient preparation method. 9 cl, 18 tbl, 31 tbl

Настоящее изобретение относится к новым производным фенилалканамидов и сельскохозяйственным или садовым фунгицидам, содержащим их в качестве активных ингредиентов.

До сих пор N-фенилацетаминитрилы, такие как

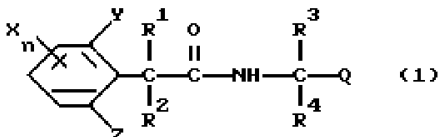
N-(1-циано-1-циклопропилэтил)-2-(2,4-дихлорфенил)ацетамид и подобные соединения были известны как промежуточные продукты 3-арилпирролидин-2,4-дионов (заявка на патент Японии, первая публикация, N Hei 6-220004 и заявка на патент Японии, первая публикация, N Hei 6-263731); однако полезность этих соединений в качестве сельскохозяйственных или садовых фунгицидов не известна совсем.

В последнее время фунгицидная активность обычных фунгицидов может ухудшаться вследствие появления устойчивых грибов после многократного использования этих фунгицидов. По этой причине, а также вследствие проблем окружающей среды, желательнее предложить новый фунгицид, который может эффективно подавлять вредные грибы даже при низкой концентрации.

Чтобы разработать агент, имеющий превосходящую фунгицидную активность по сравнению с обычными фунгицидами, авторы настоящего изобретения синтезировали различные новые производные фенилалканамидов и провели обширное исследование в отношении их действия на биологическую активность грибов. В результате этого авторы настоящего изобретения нашли, что новые соединения по настоящему изобретению обладают превосходной фунгицидной активностью по отношению к пирикулярриозу риса и подобным заболеваниям, в то же время не мешают росту желательных растений.

Раскрытие сущности изобретения

Настоящее изобретение представляет производные фенилалканамидов, представленные формулой (1):



где R¹ представляет атом водорода или C₁-C₄ алкильную группу,

R² представляет атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу,

каждый из R³ и R⁴ независимо представляет C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₂-C₆ алкоксиалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу или

R³ и R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклоалкильную группу от 5-членного до 7-членного кольца (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой),

Q представляет цианогруппу или группу формулы: -COR⁵ (где R⁵ представляет гидроксигруппу, C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу,

C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, феноксигруппу, бензилоксигруппу, аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу или C₁-C₆ диалкиламиногруппу),

X представляет атом галогена, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, гидроксигруппу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₂-C₆ алкенилоксигруппу, C₂-C₆ алкинилоксигруппу,

C₃-C₆ циклоалкилоксигруппу, C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, арилоксигруппу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), гетероарилоксигруппу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), C₁-C₆ алкилтиогруппу,

C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, C₁-C₄ галогеналкилтиогруппу, арилтиогруппу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена),

гетероарилтиогруппа (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), арилсульфинильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена),

арилсульфонильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу, C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу, цианогруппу или арильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой,

нитрогруппой или атомом галогена), гетероарильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), аралкильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), C₁-C₆ алкилкарбонильную группу,

арилкарбонильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), гетероарилкарбонильную группу (которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, C₁-C₄ галогеналкильной группой, C₁-C₆ алкоксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой или атомом галогена), формильную группу или C₁-C₆ алкоксикарбонильную группу,

каждый из Y и Z независимо представляет атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, цианогруппу, нитрогруппу или атом галогена и

n равно целому числу 0-3, исключая случай, когда R³ и R⁴ представляют одновременно трифторметильную группу, и

при условии, что, когда как R¹, так и R², представляют атом водорода одновременно, то как Y, так и Z, представляют атом водорода, и n равно целому числу 1-3,

а также сельскохозяйственный или садовый фунгицид, включающий производное фенилалканамида в качестве активного ингредиента.

Термины, используемые в настоящем изобретении, определяются ниже. В настоящем изобретении, например, в случае выражения "C₁-C₆", группа, показанная после "C₁-C₆", имеет от 1 до 6 атомов углерода.

Термин "C₁-C₆ алкильная группа" используют здесь для обозначения алкильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, неопентильную группу, н-гексильную группу, изогексильную группу, 3,3-диметилбутильную группу и т.п.

В качестве "C₃-C₆ циклоалкильной группы" здесь можно упомянуть, например, циклопропильную группу, циклопентильную группу, циклогексильную группу и т.п.

Термин "C₁-C₄ галогеналкильную группу" используют здесь для обозначения галогензамещенной алкильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, фторметильную группу, хлорметильную группу, дифторметильную группу, дихлорметильную группу, трифторметильную группу, пентафторметильную группу и т.п.

Термин "C₂-C₆ алкенильную группу" используют здесь для обозначения алкенильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, винильную группу, 1-пропенильную группу, аллильную группу, изопропенильную группу, 1-бутенильную группу, 2-бутенильную группу и т.п.

Термин "C₂-C₆ алкинильную группу" используют здесь для обозначения алкинильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не

ограничиваясь ими, этинильную группу, 1-пропинильную группу, 2-пропинильную группу, 1-бутинильную группу, 2-бутинильную группу, 3-бутинильную группу, 4-метил-1-пентинильную группу, 3-метил-1-пентинильную группу и т.п.

В качестве "арильной группы" можно упомянуть здесь, например, фенильную группу, 1-нафтильную группу, 2-нафтильную группу и т.п.

В качестве "гетероарильной группы" здесь можно упомянуть, например, 2-пиридинильную группу, 3-пиридинильную группу, 4-пиридинильную группу, 2-фурильную группу, 3-фурильную группу, 2-тиенильную группу, 3-тиенильную группу, 1-пиррольную группу, 2-пиррольную группу, 3-пиррольную группу и т.п.

Термин "аралкильная группа" используют здесь для обозначения арил (имеет такое же значение, как определено выше) замещенной C₁-C₃ алкильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, бензильную группу, фенетильную группу, 1-нафтилметильную группу, 2-нафтилметильную группу и т.п.

Термин "атом галогена" используют здесь для обозначения атома фтора, атома хлора, атома брома или атома иода.

Термин "C₁-C₆ алкоксигруппа" используют здесь для обозначения алкоксигруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, н-пентилоксигруппу, изопентилоксигруппу, н-гексилоксигруппу и т.п.

Термин "C₂-C₆ алкенилоксигруппа" используют здесь для обозначения алкенилоксигруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, аллилоксигруппу, изопропенилоксигруппу, 2-бутенилоксигруппу и т.п.

Термин "C₂-C₆ алкинилоксигруппа" используют здесь для обозначения алкинилоксигруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, 2-пропенилоксигруппу, 2-бутинилоксигруппу, 3-бутинилоксигруппу и т.п.

В качестве "C₃-C₆ циклоалкилоксигруппы" здесь можно упомянуть, например, циклопропилоксигруппу, циклопентилоксигруппу, циклогексилоксигруппу и т.п.

Термин "C₁-C₄ галогеналкоксигруппа" используют здесь для обозначения галогензамещенной алкоксигруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, фторметоксигруппу, дифторметоксигруппу, трифторметоксигруппу, пентафторэтоксигруппу и т.п.

В качестве "арилоксигруппы" здесь можно упомянуть, например, феноксигруппу, 1-нафтилоксигруппу, 2-нафтилоксигруппу и т.п.

В качестве "гетероарилоксигруппы" можно упомянуть, например, 2-пиридилоксигруппу, 3-пиридилоксигруппу, 4-пиридилоксигруппу, 2-фурилоксигруппу, 3-фурилоксигруппу, 2-тиенилоксигруппу, 3-тиенилоксигруппу и т.п.

Термин "аралкилоксиогруппа" используют здесь для обозначения арилзамещенной C_1-C_3 алкоксиогруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, бензилоксиогруппу, фенетилоксиогруппу и т.п.

Термин " C_1-C_6 алкилтиогруппа" используют здесь для обозначения алкилтиогруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метилтиогруппу, этилтиогруппу, н-пропилтиогруппу, изопротилтиогруппу, н-бутилтиогруппу, изобутилтиогруппу, втор-бутилтиогруппу, трет-бутилтиогруппу, н-гексилтиогруппу и т.п.

Термин " C_1-C_6 алкилсульфинильная группа" используют здесь для обозначения алкилсульфинильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метилсульфинильную группу, этилсульфинильную группу, н-пропилсульфинильную группу, изопротилсульфинильную группу, н-бутилсульфинильную группу, изобутилсульфинильную группу, втор-бутилсульфинильную группу, трет-бутилсульфинильную группу, н-гексилсульфинильную группу и т.п.

Термин " C_1-C_6 алкилсульфонильная группа" используют здесь для обозначения алкилсульфонильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метилсульфонильную группу, этилсульфонильную группу, н-пропилсульфонильную группу, изопротилсульфонильную группу, н-бутилсульфонильную группу, изобутилсульфонильную группу, втор-бутилсульфонильную группу, трет-бутилсульфонильную группу, н-гексилсульфонильную группу и т.п.

Термин " C_1-C_4 галогеналкилтиогруппа" используют здесь для обозначения галогензамещенной алкилтиогруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, фторметилтиогруппу, дифторметилтиогруппу, трифторметилтиогруппу, пентафтортиогруппу и т.п.

В качестве "арилтиогруппы" здесь можно упомянуть, например, фенилтиогруппу, 1-нафтилтиогруппу, 2-нафтилтиогруппу или тому подобное.

В качестве "гетероарилтиогруппы" можно упомянуть, например, 2-пиридилтиогруппу, 3-пиридилтиогруппу, 4-пиридилтиогруппу, 2-фурилтиогруппу, 3-фурилтиогруппу, 2-тиенилтиогруппу, 3-тиенилтиогруппу и т.п.

В качестве "арилсульфинильной группы" здесь можно упомянуть, например, фенилсульфинильную группу, 1-нафтилсульфинильную группу, 2-нафтилсульфинильную группу и т.п.

В качестве "арилсульфонильной группы" здесь можно упомянуть фенилсульфонильную группу, 1-нафтилсульфонильную группу, 2-нафтилсульфонильную группу и т.п.

Термин " C_1-C_6 алкиламиногруппа" используют здесь для обозначения алкиламиногруппы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, например, метиламиногруппу, этиламиногруппу,

н-пропиламиногруппу, изопрпиламиногруппу, н-бутиламиногруппу, изобутиламиногруппу, втор-бутиламиногруппу, трет-бутиламиногруппу, н-гексиламиногруппу и т.п.

5 В качестве " C_1-C_6 диалкиламиногруппы" можно упомянуть, например, диметиламиногруппу, диэтиламиногруппу, дипропиламиногруппу, дибутиламиногруппу и т.п.

10 Термин " C_1-C_6 алкилкарбонильная группа" используют здесь для обозначения алкилкарбонильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, например, ацетильную группу, пропионильную группу, бутилильную группу, изобутилильную группу и т.п.

15 В качестве "арилкарбонильной группы" здесь можно упомянуть, например, бензоильную группу, 1-нафтилкарбонильную группу, 2-нафтилкарбонильную группу и т.п.

20 В качестве "гетероарилкарбонильной группы" здесь можно упомянуть, например, 2-пиридилкарбонильную группу, 3-пиридилкарбонильную группу, 4-пиридилкарбонильную группу, 2-фурилкарбонильную группу, 3-фурилкарбонильную группу, 2-тиенилкарбонильную группу, 3-тиенилкарбонильную группу и т.п.

25 Термин " C_1-C_6 алкоксикарбонильная группа" используют здесь для обозначения алкоксикарбонильной группы с неразветвленной или разветвленной цепью, включая, например, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопророксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу, 35 изобутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, трет-бутоксикарбонильную группу, н-пентилоксикарбонильную группу, н-гексилоксикарбонильную группу и т.п.

40 Соединения, представленные формулой (1) по настоящему изобретению, могут существовать в виде оптических изомеров благодаря присутствию одного или нескольких хиральных центров в молекуле. Настоящее изобретение относится ко всем таким диастереомерам энантиомерам и их смесям.

Предпочтительными соединениями, представленными формулой (1) по настоящему изобретению, являются соединения, у которых:

50 R^1 представляет атом водорода или метильную группу,

R^2 представляет атом водорода, метильную группу или этильную группу,

55 R^3 представляет метильную группу, этильную группу или н-пропильную группу,

R^4 представляет метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопротильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, циклопропильную 60 группу, циклопентильную группу или дихлорметильную группу,

Q представляет цианогруппу, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопророксикарбонильную группу,

н-бутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу или карбамоильную группу,

X представляет атом фтора, атом хлора, атом брома, атом иода, метильную группу, этильную группу, изопропильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, циклопентильную группу, циклогексильную группу, трифторметильную группу, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, дифторметоксигруппу, трифторметоксигруппу, феноксигруппу, метилтиогруппу, этилтиогруппу, изопропилтиогруппу, диметиламиногруппу, диэтиламиногруппу, нитрогруппу, цианогруппу, фенильную группу, ацетильную группу или бензоильную группу,

каждый из Y и Z независимо представляет атом водорода или атом фтора и n равен целому числу 1-3.

Далее представленные примеры соединений, представленных формулой (1) по настоящему изобретению, перечисляются в таблицах 1-24. Однако должно быть понятно, что настоящее изобретение не ограничивается этими соединениями. Номера соединений, данные в таблицах, будут указываться далее в описании.

В таблицах "Me" означает метильную группу,

"Et" обозначает этильную группу,
 "Pr-n" обозначает пропильную группу,
 "Pr-i" обозначает изопропильную группу,
 "Bu-n" обозначает н-бутильную группу,
 "Bu-i" обозначает изобутильную группу,
 "Bu-s" обозначает втор-бутильную группу,
 "Bu-t" обозначает трет-бутильную группу,
 "Pr-cyc" обозначает циклопропильную

группу,
 "Pen-cyc" обозначает циклопентильную группу,

"Ph" обозначает фенильную группу,
 "4-OPh(2-Cl)" обозначает 4-(2-хлорфенил)оксигруппу,
 "4-O(2-Py)" обозначает 4-(2-пиридил)оксигруппу,
 "4-O(5-CF₃,2-Py)" обозначает 4-(5-трифторметил-2-пиридил)- оксигруппу,
 "4-O(3-Py)" обозначает 4-(3-пиридил)оксигруппу,
 "4-O(4-Py)" обозначает 4-(4-пиридил)оксигруппу,

"4-SPh(2-Cl)" обозначает 4-(2-хлорфенил)тиогруппу,
 "4-S(O)Ph(2-Cl)" обозначает 4-(2-хлорфенил)сульфинильную группу,
 "4-SO₂Ph(2-Cl)" обозначает 4-(2-хлорфенил)сульфонильную группу,

"4-S(2-Py)" обозначает 4-(2-пиридил)тиогруппу,
 "4-Ph(4-CF₃)" обозначает 4-(4-трифторметилфенильную) группу,

"4-(2-Py)" обозначает 4-(2-пиридил)ную группу,
 "4-(2-Fur)" обозначает 4-(2-фурильную) группу,
 "4-(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенильную) группу,

"4-COPh(2-Me)" обозначает 4-(2-метилбензоильную) группу,
 "4-CO(3-Py)" обозначает 4-(3-пиридил)карбонильную группу,
 "4-CO(2-Fur)" обозначает 4-(2-фурил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,

"4-CO(2-Thi)" обозначает 4-(2-тиенил)карбонильную группу,
 "4-CH₂Ph(3-Cl)" обозначает 4-(3-хлорбензильную) группу и

"4-(1-Pyrr)" обозначает 4-(1-пиррольную) группу.

5

Соединения NN C-42, C-43, C-196, C-197, C-198 и C-199 являются оптически активными соединениями, имеющими углы вращения $[\alpha]_D^{22} = +32,7^\circ$ (c = 0,5, CHCl₃), $[\alpha]_D^{22} = -27,3^\circ$ (c = 0,5, CHCl₃), $[\alpha]_D^{22} = +9,8^\circ$ (c = 1,0, CHCl₃), $[\alpha]_D^{22} = +23,4^\circ$ (c = 1,0, CHCl₃), $[\alpha]_D^{22} = -8,4^\circ$ (c = 1,0, CHCl₃) и $[\alpha]_D^{22} = -19,9^\circ$ (c = 1,0, CHCl₃), соответственно.

10

15

Соединения NN C-16, C-17, C-18, C-21, C-24, C-27, C-34, C-39, C-47, C-51, C-54, C-62, C-66, C-71, C-73, C-75, C-81, C-88, C-92, C-94, C-99, C-102, C-106, C-108, C-112, C-114, C-117, C-122, C-129, C-131, C-140, C-157, C-161, C-165, C-169, C-171, C-174, C-177, C-179, C-181, C-184, C-187, C-189, C-193, C-196, C-198, C-200, D-40, D-63, D-91, D-119, E-30 и E-37 являются А-конфигурационными диастереомерами.

20

25

Соединения NN C-19, C-22, C-25, C-28, C-35, C-40, C-48, C-52, C-55, C-63, C-67, C-72, C-74, C-76, C-82, C-89, C-93, C-95, C-100, C-103, C-107, C-109, C-113, C-115, C-118, C-123, C-130, C-141, C-158, C-162, C-166, C-170, C-172, C-175, C-178, C-180, C-182, C-185, C-188, C-190, C-194, C-197, C-199, C-201, D-41, D-64, D-92, D-120, E-31 и E-38 являются В-конфигурационными диастереомерами. Кроме того, другие соединения, имеющие два или более асимметричных атомов углерода, являются смесями диастереомеров.

30

35

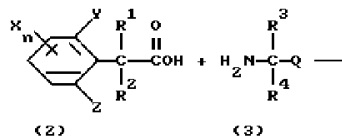
"А-конфигурационный диастереомер" обозначает низкополярный диастереомер, выделенный колоночной хроматографией на силикагеле, высокоэффективной жидкостной хроматографией или подобным способом, тогда как "В-конфигурационный диастереомер" обозначает высокополярный диастереомер, выделенный таким же способом, как указано выше.

40

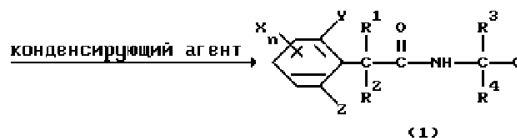
Соединения, представленные формулой (1), можно синтезировать в соответствии, например, со способами получения, показанными ниже.

Способ получения 1

50



55



где R¹, R², R³, R⁴, X, Y, Z, Q и n имеют такие значения, как определено выше).

60

Соединения формулы (1) по настоящему изобретению можно получить реакцией производных фенилалкановых кислот, представленных формулой (2), и аминов, представленных формулой (3), с использованием конденсирующего агента в присутствии катализатора и/или основания,

-7-

если необходимо.

Данную реакцию можно проводить в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не препятствует реакции, например, углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол и тому подобное, галогенированные углеводороды такие как метилхлорид, дихлорэтан, хлороформ, тетрагидрофуран, дихлорбензол и тому подобные, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и тому подобные, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон, метилизобутилкетон и тому подобные, сложные эфиры, такие как метилацетат, этилацетат и тому подобные, нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил и тому подобные, апротонные полярные растворители, такие как диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид, сульфолан и тому подобные, и смеси растворителей, объединяющие растворители, выбранные из вышеупомянутых.

В качестве конденсирующего агента можно упомянуть гидрохлорид 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодимида, N,N'-дициклогексилкарбодимид, карбонилдиимдазол, хлорид 2-хлор-1,3-диметиламидазолия и т.п.

В качестве катализатора можно упомянуть, например, 4-диметиламинопиридин, 1-гидроксибензотриазол, диметилформамид и т.п.

Основанием может быть любой тип основания, обычно используемого в этом типе реакции. Можно упомянуть, например, гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия и тому подобное, гидроксиды щелочноземельных металлов, такие как гидроксид кальция и тому подобные, карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия и тому подобные, органические основания, такие как триэтиламин, триметиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиперидин, 1,5-диазабицикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN), 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU) и тому подобные, и амины, такие как триэтиламин, пиридин, N-метилпиперидин и тому подобные.

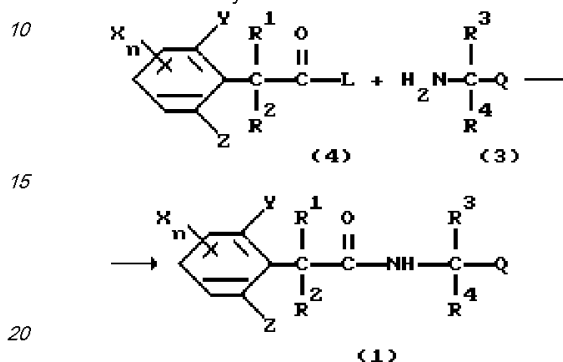
Данную реакцию проводят при температуре от -50 до 150°C, предпочтительно от 0 до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Далее приводится объяснение способа синтеза каждого из исходных соединений.

Соединения, представленные формулой (2), можно синтезировать, например, гидролизом фенолмалонатов при помощи щелочи, нагреванием гидролизованного продукта и последующим декарбонилированием нагретого продукта. Этот способ получения описывается в Journal of Organic Chemistry, vol. 13, p. 763 (1948); Organic Syntheses, vol. 3, p. 557, 1955; заявке на патент Японии, первая публикация, N Sho 40-7491 и Synthesis, vol. 6, p. 456, 1982.

Кроме того, соединения, представленные формулой (3), можно синтезировать, например, с использованием кетона, цианида натрия и хлорида аммония в соответствии со способом Strecker, который описывается в Organic Synthesis, vol. 3, p. 88, 1955; Journal of Medicinal Chemistry, vol. 9, p. 911, 1966 Tetrahedron Letters, vol. 17, p. 1455, 1977.

Способ получения 2



(где R¹, R², R³, R⁴, X, Y, Z, Q и n имеют такие значения, как определено выше, и L представляет атом галогена).

Соединения, представленные формулой (1) по настоящему изобретению, можно получить реакцией галогенангидридов фенолалкановых кислот, представленных формулой (4), и аминов, представленных формулой (3).

Данную реакцию можно проводить в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не препятствует реакции, например углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол и тому подобные, галогенированные углеводороды, такие как метилхлорид, дихлорэтан, хлороформ, тетрагидрофуран, дихлорбензол и тому подобные, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и тому подобные, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон, метилизобутилкетон и тому подобные, сложные эфиры, такие как метилацетат, этилацетат и тому подобные, нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил и тому подобные, апротонные полярные растворители, такие как диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид, сульфолан и тому подобные, и смеси растворителей, объединяющие растворители, выбранные из вышеупомянутых.

Основанием может быть любой тип основания, обычно используемого в этом типе реакции. Можно упомянуть, например, гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия и тому подобные, гидроксиды щелочноземельных металлов, такие как гидроксид кальция и тому подобные, карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия и тому подобные, органические основания, такие как триэтиламин, триметиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиперидин, 1,5-диазабицикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN), 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU) и тому подобные, и амины, такие как

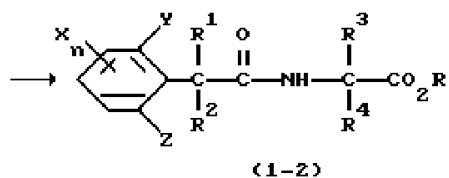
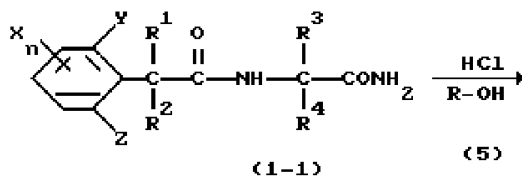
триэтиламин, пиридин, N-метилпиперидин и тому подобные.

Данную реакцию проводят при температуре от -50 до 150°C, предпочтительно от 0 до 60°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 30 часов.

Далее дается объяснение способа получения исходных соединений, используемых в указанном способе.

Галогенангидриды фенилалкановых кислот, представленные формулой (4), можно получить реакцией фенилалкановых кислот, представленных формулой (2), полученных, например, вышеупомянутым способом, и галогенирующих агентов, таких как тионилхлорид, пентахлорид фосфора, трибромид фосфора или тому подобные.

Способ получения 3



(где R¹, R², R³, R⁴, X, Y, Z и n имеют такие значения, как определено выше, и R представляет C₁-C₆ алкильную группу).

Соединения, представленные формулой (1-2) по настоящему изобретению, можно получить реакцией соединений, представленных формулой (1-1) настоящего изобретения, и спиртов, представленных формулой (5), которые насыщены хлоридом водорода.

Данную реакцию можно проводить в растворителе: этим растворителем может быть любой растворитель, который не препятствует реакции, например спирты, такие как метанол, этанол, пропанол, изопропанол, бутанол и тому подобные, углеводороды, такие как пентан, гексан, гептан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол и тому подобные, галогенированные углеводороды, такие как метиленхлорид, дихлорэтан, хлороформ, тетрагидрид углерода, хлорбензол, дихлорбензол и тому подобные, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диметиловый эфир этиленгликоля, тетрагидрофуран, диоксан и тому подобные и смеси растворителей, объединяющие растворители, выбранные из вышеупомянутых.

Данную реакцию проводят при температуре от -50 до 150°C, предпочтительно от 0 до 120°C. Время реакции предпочтительно находится в диапазоне от 1 до 20 часов.

Лучшие способы осуществления настоящего изобретения

Ниже приводятся примеры получения соединений по настоящему изобретению.

Пример получения 1

Синтез

N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(4-бифенил)ацетамида (соединение N A-87)

1,1 г (5,7 ммоль) гидрохлорида 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодимида добавляют к раствору, содержащему 1,0 г (4,5 ммоль) 4-бифенилуксусной кислоты, растворенной в 50 мл метиленхлорида, при комнатной температуре и смесь перемешивают в течение 10 мин. Затем по каплям добавляют 0,5 г (4,7 ммоль) 2-амино-2,3-диметилбутиронитрила и всю смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к получаемой смеси добавляют воду и слой метиленхлорида промывают водой и затем сушат над безводным сульфатом магния. Метиленхлорид удаляют из органического слоя при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, таким образом получая 1,1 г (выход: 76%) целевого соединения, имеющего точку плавления 151-152°C.

Пример получения 2

Синтез

N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(4-бромфенил)пропионамида (соединения NN C-47 и C-48)

0,9 г (8,0 ммоль) 2-амино-2,3-диметилбутиронитрила и 0,8 г (7,9 ммоль) триэтиламина растворяют в 20 мл тетрагидрофурана. К этой смеси, которую перемешивают при 10°C, в течение 5 минут по каплям добавляют 1,5 г (6,0 ммоль) 2-(4-бромфенил)пропионилхлорида. После окончания прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 5 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и затем к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. Этилацетат из органического слоя удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, таким образом получая 0,45 г (выход 24%) A-конфигурационного диастереомера (низкополярный продукт), имеющего точку плавления 130-131°C и 0,75 г (выход 40%) B-конфигурационного диастереомера (высокополярный продукт), имеющего точку плавления 121-123°C.

Пример получения 3

Синтез

N-(1-карбамоил-1-этилпропил)-2-(4-хлорфенил)пропионамида (соединение N D-32)

2,3 г (18 ммоль) 2-амино-2-этилбутиламида, 2,0 г (20 ммоль) триэтиламина суспендируют в 50 мл тетрагидрофурана. Тетрагидрофурановый раствор (10 мл), содержащий 3,0 г (15 ммоль) растворенного в нем 2-(4-хлорэтил)пропионилхлорида, добавляют по каплям в течение 10 минут в суспензию, которую перемешивают при комнатной температуре. После окончания прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и затем к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют хлороформом и затем сушат над безводным сульфатом магния. Хлороформ удаляют из органического слоя при пониженном давлении. Полученные

кристаллы промывают диизопропиловым эфиром, таким образом получая 4,2 г (выход 95%) целевого продукта, имеющего точку плавления 116-118°C.

Пример получения 4

Синтез

метил-2-[1-(4-хлорфенил)этилкарбониламино]-2-этилбутирата (соединение N D-28) 0,6 г (2,0 ммоль) N-(1-карбамоил-1-этилпропил)-2-(4-хлорфенил)пропионамида растворяют в 10 мл насыщенного хлоридом водорода метанола. Раствор кипятят с обратным холодильником в течение 3 часов. Реакционную смесь концентрируют и затем к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. Этилацетат из органического слоя удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, таким образом получая 0,5 г (выход 81%) целевого продукта, имеющего точку плавления 98-99 °С.

Пример получения 5

Синтез

N-(1-циано-1-циклопропилэтил)-2-(4-хлорфенил)-2-метилпропионамида (соединение N E-9) 0,25 г (2,3 ммоль) 2-амино-2-циклопропилпропionитрила и 0,3 г (3,0 ммоль) триэтиламина растворяют в 20 мл тетрагидрофурана. По каплям к смеси, которую перемешивают при 10°C, в течение 5 минут добавляют 0,5 г (2,3 ммоль) 2-(4-хлорфенил)-2-метилпропионилхлорида. После окончания прикапывают реакционную смесь перемешивают в течение 3 часа при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и затем к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом и затем сушат над безводным сульфатом магния. Этилацетат из органического слоя удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, таким образом получая 0,5 г (выход 75%) целевого продукта, имеющего точку плавления 93-94 °С.

Пример получения 6

Синтез

изопропил-2-(4-трифторметилбензилкарбонил amino)-2,3- диметилбутирата (соединение N B-36) 1,1 г (5,7 ммоль) гидрохлорида 1-этил-3-(3-диметиламинопропил) карбодиимида добавляют к раствору, содержащему 1,0 г (4,9 ммоль) 4-трифторметилфенилуксусной кислоты, растворенной в 50 мл метиленхлорида, при комнатной температуре, и смесь затем перемешивают в течение 10 минут. К ней добавляют 0,9 г (5,2 ммоль) изопропил-2-амино-2,3-диметилбутирата и всю смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной смеси добавляют воду. Слой метиленхлорида промывают водой и затем сушат над безводным сульфатом магния. Метиленхлорид удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, таким образом получая 1,4 г (выход 80%) целевого продукта, имеющего точку плавления

122-123 °С.

Сельскохозяйственные и садовые фунгициды по настоящему изобретению включают в качестве активных ингредиентов производные фенилалканамидов, представленные формулой (1). В случае, когда соединения по настоящему изобретению используют в качестве сельскохозяйственных и садовых фунгицидов, эти соединения, действующие в качестве активных ингредиентов, можно приготовить в виде подходящей готовой препаративной формы, зависящей от цели использования. Активный ингредиент обычно разбавляют инертным жидким или твердым носителем и, если необходимо, к нему добавляют поверхностно-активное вещество и т.п. Смесь затем превращают известным способом в готовую препаративную форму, например, тонкоизмельченный порошок, смачивающийся порошок, эмульгирующийся концентрат, гранулы и т.п.

В качестве подходящих носителей, используемых в готовой препаративной форме, можно упомянуть твердые носители, такие как тальк, бентонит, глину, каолин, диатомовую землю, белую сажу, вермикулит, гашеную известь, кремниевый песок, сульфат аммония, мочевины или тому подобные, и жидкие носители, такие как изопропиловый спирт, ксилитол, циклогексанон, метилнафталин и тому подобные. В качестве поверхностно-активных веществ и диспергаторов можно упомянуть динафтилметандисульфат, сульфаты спиртов, алкиларилсульфонаты, лигнинсульфонаты, полиоксиэтиленгликолевые простые эфиры, полиоксиэтиленалкиларилловые простые эфиры, моноалкилаты полиоксиэтиленсорбита и тому подобные. В качестве вспомогательных агентов можно упомянуть карбоксиметилцеллюлозу и тому подобные. Превращенный в готовую препаративную форму сельскохозяйственный или садовый фунгицид по настоящему изобретению можно развести до подходящей разбавленной концентрации или можно применять непосредственно.

Сельскохозяйственный или садовый фунгицид по настоящему изобретению можно использовать для разбрызгивания на стебли или листья, внесения в землю и применения погружением. Пропорцию активного ингредиента выбирают по потребности. Когда фунгицид превращают в форму мелкоизмельченного порошка или гранул, содержание активного ингредиента предпочтительно составляет от 0,1 до 20% по массе. Для эмульгирующегося концентрата или смачивающегося порошка активный ингредиент предпочтителен в количестве от 5 до 80% по массе.

Доза применения сельскохозяйственного или садового фунгицида по настоящему изобретению может изменяться в зависимости от типа соединений, типа вредителя или болезни, которую нужно подавить, природы вредителя или болезни, степени повреждения, условий окружающей среды, формы используемого препарата и тому подобное. Когда сельскохозяйственный или садовый фунгицид по настоящему изобретению применяют непосредственно в форме порошка или гранул, рекомендуется,

чтобы доза применения активного ингредиента была подходящим образом выбрана в пределах диапазона от 0,1 до 5 кг на 10 ар, предпочтительно в диапазоне от 1 г до 1 кг на 10 ар. Кроме того, когда фунгицид настоящего изобретения находится в форме жидкости, такой как эмульгируемый концентрат или смачиваемый порошок, рекомендуется, чтобы доза применения активного ингредиента была подходящим образом выбрана в пределах диапазона от 0,1 ч./млн. до 10000 ч./млн., предпочтительно в диапазоне от 10 ч./млн. до 3000 ч./млн.

Сельскохозяйственный или садовый фунгицид по настоящему изобретению в упомянутой выше готовой препаративной форме может подавлять болезни растений, вызванные патогенными грибами Oomycetes, Ascomycetes, Deuteromycetes, Oomycetes и Basidiomycetes.

Ниже перечисляются примеры грибов, но они не ограничиваются этими грибами: Pyricularia, такие как грибы пирикулярриоза риса (Pyricularia oryzae), Sphaerotheca, такие как грибы настоящей мучнистой росы огурцов (Sphaerotheca fuliginea), Venturia, такие как грибы парши яблوك (Venturia inaequalis), Gibberella, такие как грибы болезни "баканаэ" (Gibberella fujikuroi), Botrytis, такие как грибы серой гнили огурцов (Botrytis cinerea), Alternaria, такие как грибы черной пятнистости горчицы сарептской (Alternaria Brassicicola), Rhizoctonia, такие как грибы ризоктониоза риса (Rhizoctonia solani), Puccinia, такие как грибы ржавчины (Puccinia recondita), Pseudoperonospora, такие как грибы ложной мучнистой росы огурцов Pseudoperonospora cubensis).

Кроме того, соединения по настоящему изобретению можно использовать как таковые или в сочетании с другими фунгицидами, инсектицидами, гербицидами, модификаторами роста растений, удобрениями или тому подобным. Далее представительные готовые препаративные формы иллюстрируются со ссылкой на следующие примеры готовых препаративных форм, где все "%" представляют "проценты по массе".

Пример состава 1: Тонкоизмельченный порошок

2% соединения N A-4, 5% диатомовой земли и 93% глины смешивают до образования однородной смеси и размалывают в тонкоизмельченный порошок.

Пример состава 2: Смачивающийся порошок

50% соединения N B-6, 45% диатомовой земли, 2% динавилметандисульфата натрия и 3% лигнинсульфоната натрия смешивают до образования однородной смеси и размалывают в смачивающийся порошок.

Пример состава 3: Эмульгирующийся концентрат

30% соединения N C-29, 20% циклогексанона, 11% полиоксиэтиленалкиларилового эфира, 4% алкилбензолсульфоната кальция и 35% метилнафталина равномерно растворяют, таким образом получая эмульгирующийся концентрат.

Пример состава 4: Гранулы

5% соединения N B-34, 2% натриевой соли сульфата лаурилового спирта, 5% лигнинсульфоната натрия, 2% карбоксиметилцеллюлозы и 86% глины смешивают и размалывают. К 100 частям по массе размолотой смеси добавляют 20 частей по массе воды. Получаемую смесь разминают и превращают в гранулы размера от 14 до 32 меш. при помощи экструзионного гранулятора и затем сушат, получая целевые гранулы.

Далее дается объяснение эффектов, которые проявляют сельскохозяйственные или садовые фунгициды по настоящему изобретению, путем ссылки на примеры испытаний. В примерах испытаний в качестве сравнительного соединения используют соединение, описанное в заявке на патент Японии, первая публикация N Hei 6-220004.

Пример испытания 1

Испытание на профилактический эффект при пирикулярриозе риса (Pyricularia oryzae)

Семена риса (сорт: Aichi Asahi) высевают при норме приблизительно по 15 зерен в каждый из фарфоровых горшков, имеющих диаметр 7 см. Семенам дают прорасти и расти в течение 3-4 недель в теплице. Смачивающийся порошок, полученный в соответствии с примером 2 готовой препаративной формой, разбавляют водой до концентрации 500 м.д. активного ингредиента и затем полученный водный препарат разбрызгивают, при норме 10 мл на горшок, на проростки риса на стадии 4-го листа. После сушки на воздухе проростки инокулируют суспензией конидиоспоры грибов пирикулярриоза риса (Pyricularia oryzae) и сразу помещают во влажную камеру для выдерживания при 25 °C в течение 24 часов и затем в теплицу. На пятый день после инокуляции подчитывают число поврежденных на четвертом листе. Подавляющую активность вычисляют по уравнению 1. Результаты оценки, полученные в соответствии со стандартом оценки, показанном в таблице 25, приводятся в таблицах 26-28.

Уравнение 1

$$\text{Подавляющая активность (\%) = } \left(1 - \frac{\text{Число повреждений в обработанном горшке}}{\text{Число повреждений в необработанном горшке}} \right) \times 100$$

Пример 2 испытания

Испытание эффекта при пирикулярриозе риса (Pyricularia oryzae) при применении погружением.

Проростки риса (сорт: Aichi Asahi) на стадии 2-го листа высаживают 4 пятнами при норме 3 проростка на участок в белые фарфоровые емкости, имеющие диаметр 9 см. Проросткам дают развиваться и расти в теплице. Когда проростки вырастают до стадии 3-го листа, гранулы, полученные в соответствии с примером состава 4, вносят в поливную воду и горшок так, чтобы концентрация активного ингредиента была 300 г на 10 ар. Когда четвертый лист полностью разовьется, проростки инокулируют суспензией спор пирикулярриоза риса (Pyricularia oryzae) и сразу помещают во влажную камеру для выдерживания при 25 °C в течение 24 часов и затем в теплицу так, чтобы индуцировать поражение болезнью. На пятый день после инокуляции

подсчитывают число повреждений на четвертом листе. Подавляющую активность вычисляют по уравнению 1. Результаты оценки, полученные в соответствии со стандартом оценки, показанном в таблице 25, приводятся в таблице 29.

Пример испытания 3

Испытание на профилактическое влияние на яблоневую паршу (*Venturia inaequalis*)

Семена яблок (сорт: Jonathan) высевают при норме 4 зерна в пластиковые горшки, имеющие диаметр 5,5 см. Смачивающийся порошок, полученный в соответствии с примером состава 2, разбавляют водой до концентрации 50 ч./млн. активного ингредиента и затем полученный водный препарат разбрызгивают, при норме 20 мл на горшок, на проростки яблок, у которых полностью развился настоящий четвертый лист. После сушки на воздухе проростки инокулируют суспензией спор грибов парши яблок (*Venturia inaequalis*) и сразу помещают во влажную камеру для выдерживания при 20 °С в течение 48 часов и затем в теплицу. На четырнадцатый день после инокуляции осматривают инфицированную площадь на листьях. Индекс заболеваемости вычисляют в соответствии со стандартом оценки, показанным в таблице 30, с использованием индекса заболеваемости и числа инфицированных листьев, степень повреждения вычисляют в соответствии с уравнением 2 и подавляющую активность вычисляют в соответствии с уравнением 3. Полученную подавляющую активность оценивают в соответствии со стандартом оценки, показанным в таблице 25, результаты приводятся в таблице 31.

Уравнение (2):

$$\text{Степень повреждения} \langle \times \rangle = \frac{\sum \text{индекс заболеваемости } x}{4 \times \text{число осмотренных листьев}} \times 100$$

Уравнение (3):

$$\text{Подавляющая активность} \langle \times \rangle = \left[1 - \frac{\text{Степень повреждения обработанного горшка}}{\text{Степень повреждения необработанного горшка}} \right] \times 100$$

Пример получения 7

Синтез

2-(4-хлорфенил)-N-(1-изопропил-1-метил-2-оксопропил)ацетамида (соединение N B-15).

4-хлорфенилуксусную кислоту (1,0 г, 5,9 ммоль) растворяют в метилхлориде (50 мл). К ней при комнатной температуре добавляют гидрохлорид

1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодимид (1,5 г, 7,8 ммоль) и смесь перемешивают в течение 10 минут. К смеси добавляют 3-амино-3,4-диметил-2-пентанон (0,8 г, 6,2 ммоль) и смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной смеси добавляют воду. Слой метилхлорида промывают водой и сушат над безводным сульфатом магния. После этого метилхлорид удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,0 г (выход: 60%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 164 до 165 °С.

Пример получения 8

Синтез

N-(1-циано-1,2,2-триметилпропил)-2-(4-бромфенил)пропионамида (соединение N C-51 и C-52).

2-амино-2,3,3-триметилбутиронитрил (1,3 г, 10,0 ммоль) и триэтиламин (1,2 г, 11,8 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (20 мл). Когда смесь перемешивают при 10 °С, к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид 2-(4-бромфенил)пропионовой кислоты (1,5 г, 6,0 ммоль). После окончания прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 8 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют, к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 0,3 г (выход: 15%) диастереомера конфигурации А, имеющего температуру плавления в диапазоне от 143 до 144 °С и 0,85 г (выход: 42%) диастереомера конфигурации В, имеющего температуру плавления в диапазоне от 150 до 152 °С.

Пример получения 9

Синтез

N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(4-трифторметоксифенил)пропионамида (соединения N C-122 и C-123).

2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (0,6 г, 5,3 ммоль) и триэтиламин (0,5 г, 5,3 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (20 мл). Когда смесь перемешивают при 10 °С, к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид

2-(4-трифторметоксифенил)пропионовой кислоты (1,1 г, 4,4 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 4 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дало в итоге 0,35 г (выход: 25%) диастереомера конфигурации А (конфигурация с низкой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 97 до 98 °С, и 0,4 г (выход: 29%) диастереомера конфигурации В (конфигурация с высокой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 122 до 124 °С.

Пример получения 10

Синтез

2-(4-хлорфенил)-N-(1-изопропил-1-метил-2-оксопропил)пропионамида (соединение N D-25).

Гидрохлорид

3-амино-3,4-диметил-2-пентанона (1,3 г, 7,8 ммоль) и карбонат калия (2,6 г, 18,7 ммоль) растворяют в ацетонитриле (20 мл). При перемешивании смеси при 10 °С к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид 2-(4-хлорфенил)пропионовой кислоты (1,7 г, 8,5 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 2 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический

слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,3 г (выход: 56%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 140 до 143°C.

Пример получения 11

Синтез N-

(1-изопропил-1-метил-2-оксопропил)-2-(4-метилфенил)пропионамида (соединение N D-50).

Гидрохлорид

3-амино-3,4-диметил-2-пентанона (1,0 г, 6,0 ммоль) и карбонат калия (2,1 г, 15,2 ммоль) растворяют в ацетонитриле (20 мл). Когда смесь перемешивают при 10°C, к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид 2-(4-метилфенил)пропионовой кислоты (1,2 г, 6,6 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 2 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,1 г (выход: 66%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 94 до 96°C.

Пример получения 12

Синтез

N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(4-трифторметилфенил)пропионамида (соединение N C-94 и C-95).

2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (0,34 г, 3,0 ммоль) и триэтиламин (0,3 г, 3,0 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (30 мл). Когда смесь перемешивают при 10°C, к ней по каплям в течение 10 минут добавляют хлорид

2-(4-трифторметилфенил)пропионовой кислоты (0,7 г, 3,0 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 0,15 г (выход: 16%) диастереомера конфигурации А (конфигурация с низкой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 121 до 124°C, и 0,3 г (выход: 32%) диастереомера конфигурации В (конфигурация с высокой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 126 до 127°C.

Пример получения 13

Синтез

2-(4-хлорфенил)-N-(1-цианоциклопентил)пропионамида (соединение N C-30).

1-амино-1-циклопентанкарбонитрила (0,5 г, 5,0 ммоль) и триэтиламин (0,7 г, 7,0 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (30 мл). При перемешивании смеси при 10°C к

ней по каплям в течение 10 минут добавляют хлорид 2-(4-хлорфенил)пропионовой кислоты (1,0 г, 5,0 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 7 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой осушают над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 0,2 г (выход: 14%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 123 до 124°C.

Пример получения 14

Синтез

2-(3,4-дихлорфенил)-N-(1-циано-1,2-диметилпропил)пропионамида (соединение N C-169 и C-170).

2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (0,5 г, 4,6 ммоль) и триэтиламин (0,46 г, 4,6 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (30 мл). При перемешивании смеси при 10°C к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид 2-(3,4-дихлорфенил)пропионовой кислоты (1,1 г, 4,6 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 3 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют, после чего к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 0,19 г (выход: 27%) диастереомера конфигурации А (конфигурация с низкой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 100 до 102°C, и 0,21 г (выход: 29%) диастереомера конфигурации В (конфигурация с высокой полярностью), имеющего температуру плавления в диапазоне от 171 до 173°C.

Пример получения 15

Синтез

N-(1-изопропил-1-метил-2-оксопропил)-2-(4-трифторметилфенил)пропионамида (соединение N D-97).

Гидрохлорид

3-амино-3,4-диметил-2-пентанона (1,3 г, 7,8 ммоль) и карбонат калия (2,6 г, 18,7 ммоль) растворяют в ацетонитриле (20 мл). Когда смесь перемешивают при 10°C, к ней по каплям в течение 5 минут добавляют хлорид 2-(4-трифторметилфенил)пропионовой кислоты (1,9 г, 8,1 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 2 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток был очищен колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,7 г (выход: 65%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 137 до 140°C.

Пример получения 16

Синтез

2-(4-хлорфенил)-N-(1-циано-1,2-диметилпропил)пропионамида (соединение N C-33).

2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (2,6 г, 23,2 ммоль) и карбонат калия (3,3 г, 23,9 ммоль) растворяют в ацетонитриле (30 мл). Когда смесь перемешивают при 10°C, к ней по каплям в течение 10 минут добавляют хлорид 2-(4-хлорфенил)пропионовой кислоты (4,5 г, 22,2 ммоль). После завершения прикапывания реакционную смесь перемешивают в течение 6 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрируют и после этого к ней добавляют воду. Органический слой экстрагируют этилацетатом. После того как этилацетатный слой был осушен над безводным сульфатом магния, этилацетат удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают жидкостной хроматографией высокого давления на колонке с силикагелем, что, таким образом, дает в итоге 4,6 г (выход: 75%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 102 до 106°C.

Пример получения 17

Синтез

N-(1-циано-1,2-диметилпропил)-2-(3-фенокси фенил)ацетамида (соединение N A-9), 3-феноксибензилуксусную кислоту (0,9 г, 5,0 ммоль) растворяют в хлороформе (50 мл). К ней при комнатной температуре добавляют гидрохлорид

1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодими да (1,2 г, 6,3 ммоль) и всю смесь перемешивают в течение 20 минут. К смеси добавляют 2-амино-2,3-диметилбутиронитрил (0,56 г, 5,0 ммоль) и реакционную смесь перемешивают в течение 8 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной смеси добавляют воду. Слой хлороформа промывают водой и сушат над безводным сульфатом магния. Хлороформ удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,2 г (выход: 72%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 136 до 137°C.

Пример получения 18

Синтез

N-(1-циано-1-дихлорметилэтил)-2-(4-хлорфенил)ацетамида (соединение N A-16).

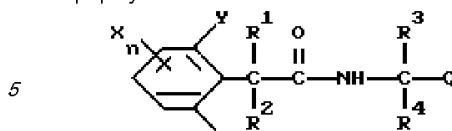
4-хлорфенилуксусную кислоту (0,85 г, 5,0 ммоль) растворяют в хлороформе (50 мл). К ней при комнатной температуре добавляют гидрохлорид

1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодими да (1,2 г, 6,3 ммоль), и всю смесь перемешивают в течение 20 минут. К смеси добавляют

2-амино-2-дихлорметилпропионитрила (0,77 г, 5,0 ммоль) и реакционную смесь перемешивают в течение 10 часов при комнатной температуре. После завершения реакции к реакционной смеси добавляют воду. Слой хлороформа промывают водой и осушают над безводным сульфатом магния. Хлороформ удаляют при пониженном давлении. Остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле, что, таким образом, дает в итоге 1,2 г (выход: 78%) целевого продукта, имеющего температуру плавления в диапазоне от 165 до 167°C.

Формула изобретения:

1. Производные фенилалканамида общей формулы 1



где R¹ означает атом водорода или C₁-C₆ алкильную группу;

10 R² означает атом водорода, C₁-C₆ алкильную группу;

15 R³ и R⁴ каждый независимо представляет C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу, C₂-C₆ алкоксильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклоалкильную группу 5-7 членного цикла, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой;

20 Q представляет цианогруппу или группу формулы -COR⁵, где R⁵ означает гидроксигруппу, C₁-C₆ алкильную группу, C₁-C₆ алкоксигруппу, аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу или C₁-C₆ диалкиламиногруппу;

25 X означает атом галогена, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу, C₁-C₄ галогеналкильную группу, гидроксигруппу, C₁-C₆ алкоксигруппу, C₃-C₆ циклоалкоксигруппу,

30 C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, арилоксигруппу, гетероарилоксигруппу, выбранную из пиридилокси и тиенилокси, C₁-C₆ алкилтиогруппу,

35 C₁-C₆ алкилсульфинильную группу, C₁-C₆ алкилсульфонильную группу, аминогруппу, C₁-C₆ алкиламиногруппу, C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу,

40 циано, арильную группу, гетероарильную группу, выбранную из пиридила или пирролила, алкилкарбонильную группу, арилкарбонильную группу, тиенилкарбонильную группу;

45 каждый из Y и Z независимо представляет атом водорода или атом галогена;

50 n равно целому числу 0-3, исключая случай, когда R³ и R⁴ представляют трифторметильную группу одновременно, и при условии, что когда R¹ и R² оба представляют водород, оба Y и Z представляют атом водорода и n представляет целое число 1-3.

55 2. Соединение по п.1, где R³ и R⁴ каждый независимо представляет C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₃-C₆ циклоалкильную группу или C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклоалкильную

60 группу 5-7 членного кольца, которая может быть замещена C₁-C₆ алкильной группой, X означает атом галогена, C₁-C₆ алкильную группу, C₂-C₆ алкенильную группу, C₂-C₆ алкинильную группу,

C₁-C₄ галогеналкильную группу, гидроксигруппу, C₁-C₆ алкоксигруппу,

C₃-C₆ циклоалкоксигруппу,
 C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, арилоксигруппу,
 гетероарилоксигруппу, выбранную из
 пиридилокси и тиенилокси,
 C₁-C₆ алкилтиогруппу,
 C₁-C₆ алкиламиногруппу,
 C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу,
 циано, арильную группу, гетероарильную
 группу, выбранную из пиридила или
 пирролила, алкилкарбонильную группу,
 арилкарбонильную группу,
 тиенилкарбонильную группу, исключая
 случай, когда R³ и R⁴ представляют
 трифторметильную группу одновременно, и
 при условии, что когда R¹ и R² оба
 представляют водород, оба Y и Z
 представляют атом водорода и n
 представляет целое число 1 - 3.

3. Соединение по п.1, где R³ и R⁴ каждый
 независимо представляет C₁-C₆ алкильную
 группу, C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₃-C₆ циклоалкильную группу или
 C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и
 R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они
 присоединены, образуют циклоалкильную
 группу 5-7 членного цикла, X означает атом
 галогена, C₁-C₆ алкильную группу,
 C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₁-C₄ галогеналкильную группу,
 гидроксигруппу, C₁-C₆ алкоксигруппу,
 C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, арилоксигруппу,
 гетероарилоксигруппу, выбранную из
 пиридилокси и тиенилокси,
 C₁-C₆ алкилтиогруппу,
 C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу,
 циано, арильную группу, алкилкарбонильную
 группу, арилкарбонильную группу,
 тиенилкарбонильную группу, исключая
 случай, когда R³ и R⁴ означают
 трифторметильную группу одновременно, и
 при условии, что когда R¹ и R² оба
 представляют водород, оба Y и Z
 представляют водород, и n равно целому
 числу 1-3.

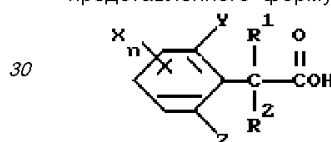
4. Соединение по п.1, где R³ и R⁴ каждый
 независимо представляет C₁-C₆ алкильную
 группу, C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₃-C₆ циклоалкильную группу или
 C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и
 R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они
 присоединены, образуют циклоалкильную
 группу 5-7 членного цикла, X означает атом
 галогена, C₁-C₆ алкильную группу,
 C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₁-C₄ галогеналкильную группу,
 C₁-C₆ алкоксигруппу,
 C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, феноксигруппу,
 C₁-C₆ алкилтиогруппу,
 C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу,
 цианогруппу, фенильную группу,
 алкилкарбонильную группу или бензоильную
 группу, Y и Z означают водород, n равно
 целому числу 1-3, за исключением того,
 что R³ и R⁴ представляют
 трифторметильную группу одновременно.

5. Соединение по п.1, где R¹ - атом
 водорода, R², R³ и R⁴ каждый независимо
 представляет C₁-C₆ алкильную группу,

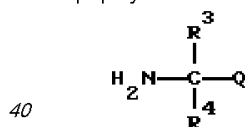
C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₃-C₆ циклоалкильную группу или
 C₁-C₄ галогеналкильную группу или R³ и
 R⁴ вместе с атомом углерода, к которому они
 присоединены, образуют циклоалкильную
 группу 5-7 членного цикла, Q означает
 цианогруппу или группу формулы -COR⁵,
 где R⁵ представляет C₁-C₆ алкокси,
 C₁-C₆ алкил или аминогруппу, X
 представляет атом галогена, C₁-C₆ алкильную
 группу, C₂-C₆ алкенильную группу,
 C₁-C₄ галогеналкильную группу,
 C₁-C₆ алкоксигруппу,
 C₁-C₄ галогеналкоксигруппу, феноксигруппу,
 C₁-C₆ алкилтиогруппу,
 C₁-C₆ диалкиламиногруппу, нитрогруппу или
 фенильную группу, Y и Z представляют атом
 водорода и n равно целому числу 1-3,
 исключая случаи, когда R³ и R⁴ представляют
 трифторметильную группу одновременно.

6. Сельскохозяйственный или садовый
 фунгицид, включающий в качестве активного
 ингредиента производное фенилалканамида,
 указанное в пп.1 - 4 или 5.

7. Способ получения производных
 фенилалканамида формулы 1 по п.1,
 включающий стадии взаимодействия
 производного фенилалкановой кислоты,
 представленного формулой 2

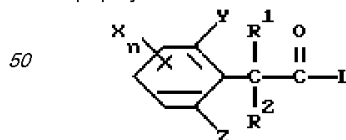


где R¹, R², X, Y, Z, и n имеют такие
 значения, как определено в п.1,
 с производным амина, представленным
 формулой 3

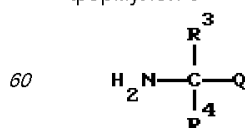


где R³, R⁴ и Q имеют такие же значения,
 как определено в п.1.

8. Способ получения производных
 фенилалканамида формулы 1 по п.1,
 включающий в стадию взаимодействия
 производного галогенангидрида
 фенилалкановой кислоты, представленного
 формулой 4

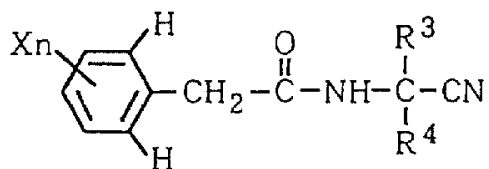


где R¹, R², X, Y, Z, и n имеют такие
 значения, как определено в п.1;
 L представляет атом галогена,
 с производным амина, представленным
 формулой 3



где R³, R⁴ и Q имеют такие значения, как
 определено в п.1.

Таблица 1



2) Но соеди- нения	Xn	R ³	R ⁴	3) Точка плавления (°C)
A- 1	3-F	Me	Pr-i	
A- 2	3-Cl	Me	Pr-i	115-116
A- 3	3-Br	Me	Pr-i	
A- 4	3-Me	Me	Pr-i	104-105
A- 5	3-OMe	Me	Pr-i	
A- 6	3-CF ₃	Me	Pr-i	125-126
A- 7	3-CN	Me	Pr-i	
A- 8	3-NO ₂	Me	Pr-i	104-105
A- 9	3-OPh	Me	Pr-i	136-137
A- 10	4-F	Me	Pr-i	100-101
A- 11	4-Cl	Me	Me	
A- 12	4-Cl	Me	Et	
A- 13	4-Cl	Me	Pr-n	
A- 14	4-Cl	Me	Pr-cyc	
A- 15	4-Cl	Me	Pr-i	122-123
A- 16	4-Cl	Me	CHCl ₂	165-167
A- 17	4-Cl	Me	Bu-i	
A- 18	4-Cl	Me	Bu-s	
A- 19	4-Cl	Me	Bu-t	151-152
A- 20	4-Cl	Et	Et	125-127
A- 21	4-Cl	Et	Pr-n	
A- 22	4-Cl	Et	Pr-i	
A- 23	4-Br	Me	Pr-i	125-126
A- 24	4-Br	Me	Bu-i	
A- 25	4-Br	Me	Bu-s	
A- 26	4-Br	Me	Bu-t	164-165

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 2

2) Но соседи- нения	X _n	R ³	R ⁴	3) Точка плавления (°C)
A- 27	4-Br	Me	CHCl ₂	
A- 28	4-Br	Et	Et	
A- 29	4-Br	Et	Pr-i	
A- 30	4-I	Me	Pr-i	125-126
A- 31	3, 4-Cl ₂	Me	Pr-i	139-140
A- 32	3, 5-Cl ₂	Me	Pr-i	
A- 33	4-Me	Me	Pr-i	100-101
A- 34	4-Et	Me	Pr-i	104-105
A- 35	4-Pr-i	Me	Pr-i	70- 71
A- 36	4-Bu-i	Me	Pr-i	
A- 37	4-C≡CMe	Me	Pr-i	
A- 38	4-CH=CHMe	Me	Pr-i	
A- 39	4-Bu-t	Me	Pen-cyc	
A- 40	4-Bu-t	Me	CF ₃	
A- 41	4-Bu-t	Me	Pr-i	97- 98
A- 42	4-Pen-cyc	Me	Bu-i	
A- 43	4-Bu-t	Me	Bu-s	
A- 44	4-Bu-t	Me	CH ₂ OMe	
A- 45	4-Bu-t	Et	Et	
A- 46	4-Bu-t	Et	Pr-n	
A- 47	4-Bu-t	Et	Pr-i	
A- 48	4-CF ₃	Me	-CH ₂ CH=CH ₂	
A- 49	4-CF ₃	Me	Et	
A- 50	4-CF ₃	Me	Pr-n	
A- 51	4-CF ₃	Me	Pr-cyc	
A- 52	4-CF ₃	Me	Pr-i	104-105
A- 53	4-CF ₃	Me	CHCl ₂	
A- 54	4-CF ₃	Me	Bu-i	94- 96
A- 55	4-CF ₃	Me	Bu-s	
A- 56	4-CF ₃	Me	Bu-t	166-167

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 3

2) Но соседи- нания	Xп	R ³	R ⁴	3) Точка плавления (°C)
A- 57	4-CF ₃	Et	Et	100-102
A- 58	4-CF ₃	Et	Pr-n	
A- 59	4-CF ₃	Me	Pr-i	
A- 60	4-OH	Me	Pr-i	152-153
A- 61	4-OMe	Me	Pr-i	107-108
A- 62	4-OEt	Me	Pr-i	96- 97
A- 63	4-OPr-i	Me	Pr-i	76- 77
A- 64	4-OBu-n	Me	Pr-i	98- 99
A- 65	4-OCH ₂ CH=CH ₂	Me	Pr-i	
A- 66	4-OCH ₂ C≡CH	Me	Pr-i	
A- 67	4-OPen-cyc	Me	Pr-i	
A- 68	4-OCF ₃	Me	Pr-i	85- 86
A- 69	4-OCF ₃	Me	Bu-i	
A- 70	4-OCF ₃	Me	Bu-s	
A- 71	4-OCF ₃	Me	Bu-t	152-154
A- 72	4-OCF ₃	Me	CF ₃	
A- 73	4-OCF ₃	Et	Et	
A- 74	3, 4-(OMe) ₂	Me	Pr-i	89- 90
A- 75	3, 4, 5-(OMe) ₃	Me	Pr-i	82- 83
A- 76	4-OPh	Me	Pr-i	139-141
A- 77	4-O(2-Py)	Me	Pr-i	
A- 78	4-O(5-CF ₃ , 2-Py)	Me	Pr-i	132-133
A- 79	4-O(3-Py)	Me	Pr-i	
A- 80	4-O(4-Py)	Me	Pr-i	
A- 81	4-SMe	Me	Pr-i	122-123
A- 82	4-SO ₂ Me	Me	Pr-i	116-118
A- 83	4-SPh	Me	Pr-i	
A- 84	4-SO ₂ Ph	Me	Pr-i	
A- 85	4-NH ₂	Me	Pr-i	
A- 86	4-N(Me) ₂	Me	Pr-i	147-148

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

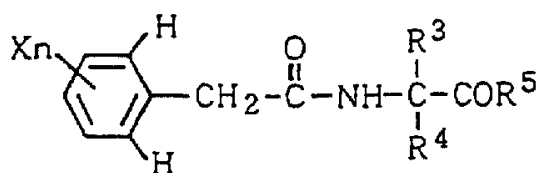
Таблица 4

2) Но соседи- нения	Xп	R ³	R ⁴	3) Точка плавления (°C)
A- 87	4-Ph	Me	Pr-i	151-152
A- 88	4-S(2-Py)	Me	Pr-i	
A- 89	4-S(4-Py)	Me	Pr-i	
A- 90	4-Ph	Me	Bu-s	
A- 91	4-Ph	Me	Bu-t	
A- 92	4-Ph	Et	Et	169-170
A- 93	4-Ph(4-CF ₃)	Me	Pr-i	
A- 94	4-Ph(2-CN)	Me	Pr-i	
A- 95	4-Ph(3-NO ₂)	Me	Pr-i	
A- 96	4-Ph(4-Cl)	Me	Pr-i	
A- 97	4-Ph(4-Me)	Me	Pr-i	
A- 98	4-Ph(4-OMe)	Me	Pr-i	
A- 99	4-(2-Py)	Me	Pr-i	
A-100	4-(3-Py)	Me	Pr-i	
A-101	4-(4-Py)	Me	Pr-i	
A-102	4-(2-Fur)	Me	Pr-i	
A-103	4-(2-Thi)	Me	Pr-i	
A-104	4-CN	Me	Pr-i	126-127
A-105	4-NO ₂	Me	Pr-i	135-136
A-106	4-COMe	Me	Pr-i	
A-107	4-COPh	Me	Pr-i	106-108
A-108	4-COPh(2-Me)	Me	Pr-i	
A-109	4-COPh(3-OMe)	Me	Pr-i	
A-110	4-COPh(4-Cl)	Me	Pr-i	
A-111	4-CO(2-Fur)	Me	Pr-i	
A-112	4-CO(2-Thi)	Me	Pr-i	
A-113	4-CO(3-Py)	Me	Pr-i	
A-114	4-CO ₂ Me	Me	Pr-i	
A-115	4-CH ₂ Ph	Me	Pr-i	
A-116	4-CH ₂ CH ₂ Ph	Me	Pr-i	
A-117	4-I	Me	Bu-t	170-172

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 5



2) No соеди-	Xn	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления
B- 1	3-Cl	Me	Pr-i	OMe	
B- 2	3-Me	Me	Pr-i	OMe	
B- 3	3-OMe	Me	Pr-i	OMe	
B- 4	3-CF ₃	Me	Pr-i	OMe	
B- 5	3-NO ₂	Me	Pr-i	OMe	
B- 6	4-Cl	Me	Pr-i	OMe	142-143
B- 7	4-Cl	Me	Pr-i	OEt	107-109
B- 8	4-Cl	Me	Pr-i	OPr-i	111-112
B- 9	4-Cl	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
B- 10	4-Cl	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 11	4-Cl	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
B- 12	4-Cl	Me	Pr-i	OPh	
B- 13	4-Cl	Me	Pr-i	NH ₂	203-204
B- 14	4-Cl	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
B- 15	4-Cl	Me	Pr-i	Me	164-165
B- 16	4-Cl	Et	Et	OMe	
B- 17	4-Cl	Et	Et	OEt	
B- 18	4-Cl	Et	Et	OPr-i	
B- 19	4-Cl	Et	Et	OCH ₂ Ph	
B- 20	4-Cl	Et	Et	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 21	4-Cl	Et	Et	OCH ₂ C≡CH	
B- 22	4-Cl	Et	Et	OPh	
B- 23	4-Cl	Et	Et	NH ₂	
B- 24	4-Cl	Et	Et	N(Me) ₂	
B- 25	4-Cl	Et	Et	Me	
B- 26	4-Cl	Me	Bu-t	OMe	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 6

2) No соеди- нения	Xп (°C)	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка
					плавления (°C)
B- 27	4-Cl	Me	Bu-t	OEt	
B- 28	4-I	Me	Pr-i	OMe	
B- 29	4-I	Me	Pr-i	OEt	
B- 30	4-I	Me	Pr-i	NH ₂	
B- 31	4-I	Et	Et	OMe	
B- 32	4-I	Et	Et	OPr-i	
B- 33	4-I	Me	Bu-t	OMe	
B- 34	4-CF ₃	Me	Pr-i	OMe	154-155
B- 35	4-CF ₃	Me	Pr-i	OEt	98- 99
B- 36	4-CF ₃	Me	Pr-i	OPr-i	122-123
B- 37	4-CF ₃	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
B- 38	4-CF ₃	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 39	4-CF ₃	Me	Pr-i	OH	
B- 40	4-CF ₃	Me	Pr-i	OPen-cyc	
B- 41	4-CF ₃	Me	Pr-i	NH ₂	218-220
B- 42	4-CF ₃	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
B- 43	4-CF ₃	Me	Pr-i	Me	
B- 44	4-CF ₃	Et	Et	OMe	
B- 45	4-CF ₃	Et	Et	OEt	
B- 46	4-CF ₃	Et	Et	OPr-i	
B- 47	4-CF ₃	Et	Et	OPen-cyc	
B- 48	4-CF ₃	CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	OMe	
B- 49	4-CF ₃	Pr-n	Pr-n	OMe	
B- 50	4-CF ₃	Et	Et	NH ₂	
B- 51	4-CF ₃	Et	Et	Me	
B- 52	4-CF ₃	Me	Bu-t	OMe	
B- 53	4-CF ₃	Me	Bu-t	OEt	
B- 54	4-CF ₃	Me	Bu-t	OPr-i	
B- 55	4-CF ₃	Me	Bu-t	OPen-cyc	
B- 56	4-CF ₃	Me	Bu-t	OCH ₂ CH=CH ₂	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 7

2) Но соеди- нения	Xn	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
B- 57	4-CF ₃	Me	Bu-t	OCH ₂ C≡CH	
B- 58	4-CF ₃	Me	Bu-t	NH ₂	
B- 59	4-CF ₃	Me	Bu-t	NHMe	
B- 60	4-CF ₃	Me	Bu-t	Pr-i	
B- 61	4-Bu-t	Me	Pr-i	OMe	
B- 62	4-Bu-t	Me	Pr-i	OEt	
B- 63	4-Bu-t	Me	Pr-i	OPr-i	
B- 64	4-Bu-t	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
B- 65	4-Bu-t	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 66	4-Bu-t	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
B- 67	4-Bu-t	Me	Pr-i	OPh	
B- 68	4-Bu-t	Me	Pr-i	NH ₂	
B- 69	4-Bu-t	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
B- 70	4-Bu-t	Me	Pr-i	Me	
B- 71	4-Bu-t	Et	Et	OMe	
B- 72	4-Bu-t	Et	Et	OEt	
B- 73	4-Bu-t	Et	Et	OPr-i	
B- 74	4-Bu-t	Et	Et	NH ₂	
B- 75	4-Pr-i	Et	Et	OMe	
B- 76	4-Pr-i	Et	Et	OEt	
B- 77	4-Pr-i	Et	Et	NH ₂	
B- 78	4-Pr-i	Et	Et	N(Et) ₂	
B- 79	4-Pr-i	Me	Pr-i	OMe	
B- 80	4-Pr-i	Me	Pr-i	OEt	
B- 81	4-Pr-i	Me	Pr-i	OPr-i	
B- 82	4-Pr-i	Me	Pr-i	NH ₂	
B- 83	4-Pr-i	Me	Pr-i	Me	
B- 84	4-Br	Me	Pr-i	OMe	
B- 85	4-Br	Me	Pr-i	OEt	
B- 86	4-Br	Me	Pr-i	OPr-i	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 8

2) Но соеди- нения	Xn	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
B- 87	4-Br	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
B- 88	4-Br	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 89	4-Br	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
B- 90	4-Br	Me	Pr-i	OPh	
B- 91	4-Br	Me	Pr-i	NH ₂	
B- 92	4-Br	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
B- 93	4-Br	Me	Pr-i	Me	
B- 94	4-Br	Et	Et	OMe	
B- 95	4-Br	Et	Et	OEt	
B- 96	4-Br	Et	Et	OPr-i	
B- 97	4-Br	Et	Et	OPen-cyc	
B- 98	4-Br	Et	Et	OCH ₂ CH=CH ₂	
B- 99	4-Br	Et	Et	NHPr-i	
B-100	4-Br	Et	Et	NH ₂	
B-101	4-Br	Et	Et	Me	
B-102	4-Br	Me	Bu-t	OMe	
B-103	4-Br	Me	Bu-t	OEt	
B-104	4-Br	Me	Bu-t	OPr-i	
B-105	4-Br	Me	Bu-t	OPen-cyc	
B-106	4-Br	Me	Bu-t	NH ₂	
B-107	4-Br	Me	Bu-t	NHMe	
B-108	4-Br	Me	Bu-t	Me	
B-109	4-OMe	Me	Pr-i	OMe	
B-110	4-OMe	Me	Pr-i	OEt	
B-111	4-OMe	Me	Pr-i	OPr-i	
B-112	4-OMe	Et	Et	OEt	
B-113	4-OMe	Et	Et	OPr-i	
B-114	4-Ph	Me	Pr-i	OMe	
B-115	4-Ph	Me	Pr-i	OEt	
B-116	4-Ph	Me	Pr-i	OMe	153-154

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

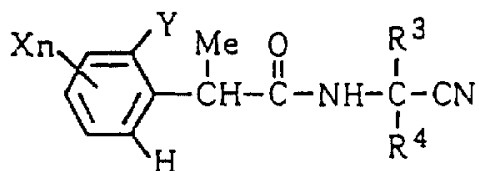
Таблица 9

2) Но соседи- нения	Xn	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
B-117	4-Ph	Me	Pr-i	OEt	
B-118	4-Ph	Me	Pr-i	OPr-i	
B-119	4-Ph	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
B-120	4-Ph	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
B-121	4-Ph	Me	Pr-i	NH ₂	
B-122	4-Ph	Me	Pr-i	NHMe	
B-123	4-Ph	Me	Pr-i	Me	
B-124	4-Ph	Et	Et	OMe	
B-125	4-Ph	Et	Et	OEt	
B-126	4-SPh	Et	Et	OMe	
B-127	4-S(O)Ph	Et	Et	OMe	
B-128	4-SO ₂ Ph	Et	Et	OMe	
B-129	4-Ph	Et	Et	NH ₂	
B-130	4-Ph	Et	Et	Pr-i	
B-131	4-Ph	Me	Bu-t	OMe	
B-132	4-Ph	Me	Bu-t	OEt	
B-133	4-Ph	Me	Bu-t	OPr-i	
B-134	4-Ph	Me	Bu-t	OPen-cyc	
B-135	4-Ph	Me	Bu-t	OMe	
B-136	4-OPr-i	Me	Pr-i	OMe	
B-137	4-OPr-i	Me	Pr-i	OEt	
B-138	4-OPr-i	Me	Pr-i	OPr-i	
B-139	4-OPr-i	Me	Pr-i	OPen-cyc	
B-140	4-OCF ₃	Me	Bu-t	OMe	125-126
B-141	4-OCF ₃	Me	Pr-i	OMe	
B-142	4-OCF ₃	Me	Pr-i	OPen-cyc	
B-143	4-OCF ₃	Me	Pr-i	NH ₂	
B-144	4-SMe	Me	Pr-i	OMe	
B-145	4-SMe	Me	Pr-i	OEt	
B-146	4-SMe	Me	Pr-i	OPr-i	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 10



2) No соединени	Xn	Y	R ³	R ⁴ 3)	Точка плавн. (°C) или показатель преломления (n _D ²⁰)
C- 1	-	H	Me	Me	132-133
C- 2	-	H	Me	Pr-сус	71- 73
C- 3	-	H	Me	Pr-i	108-110
C- 4	-	H	Et	Et	
C- 5	-	Cl	Me	Pr-i	
C- 6	-	Me	Me	Pr-i	
C- 7	-	OMe	Me	Pr-i	
C- 8	-	CF ₃	Me	Pr-i	
C- 9	-	CN	Et	Et	
C- 10	-	NO ₂	Et	Et	
C- 11	-	Me	Et	Et	
C- 12	4-Cl	F	Me	Pr-i	92-95
C- 13	4-Cl	Cl	Me	Pr-i	129-130
C- 14	4-Cl	Cl	Et	Et	
C- 15	3-F	H	Me	Pr-i	
C- 16	3-Cl	H	Me	Pr-i	1.5115
C- 17	3-Br	H	Me	Pr-i	1.5242
C- 18	3-Me	H	Me	Pr-i	71- 72
C- 19	3-Me	H	Me	Pr-i	74- 76
C- 20	3-OMe	H	Me	Pr-i	
C- 21	3-CF ₃	H	Me	Pr-i	1.4660
C- 22	3-CF ₃	H	Me	Pr-i	124-125
C- 23	3-NO ₂	H	Me	Pr-i	
C- 24	3-COPh	H	Me	Pr-i	117-119
C- 25	3-COPh	H	Me	Pr-i	1.5550
C- 26	3-CH ₂ Ph	H	Me	Pr-i	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 11

2) Но соеди- нения	Xп	Y	R ³	3) R ⁴	Точка плавл. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _D ²⁰)
C- 27	4-F	H	Me	Pr-i	127-129
C- 28	4-F	H	Me	Pr-i	124-127
C- 29	4-Cl	H	Me	Me	148-149
C- 30	4-Cl	H	-(CH ₂) ₄ -		123-124
C- 31	4-Cl	H	Me	Pr-n	88-91
C- 32	4-Cl	H	Me	Pr-cyc	l. 5318
C- 33	4-Cl	H	Me	Pr-i	102-106
C- 34	4-Cl	H	Me	Pr-i	125-126
C- 35	4-Cl	H	Me	Pr-i	133-134
C- 36	4-Cl	H	Me	CF ₃	
C- 37	4-Cl	H	Me	Bu-s	i. 5204
C- 38	4-Cl	H	Me	Bu-i	l. 5141
C- 39	4-Cl	H	Me	Bu-t	122-124
C- 40	4-Cl	H	Me	Bu-t	158-159
C- 41	4-Cl	H	Et	Et	77- 79
C- 42	4-Cl	H	Et	Et	77- 79
C- 43	4-Cl	H	Et	Et	77- 79
C- 44	4-Cl	H	Et	Pr-i	90- 93
C- 45	4-Br	H	Me	Pr-n	
C- 46	4-Br	H	Me	Pen-cyc	
C- 47	4-Br	H	Me	Pr-i	130-131
C- 48	4-Br	H	Me	Pr-i	121-123
C- 49	4-Br	H	Me	Pr-i	87- 89
C- 50	4-Br	H	Me	Bu-s	
C- 51	4-Br	H	Me	Bu-t	143-144
C- 52	4-Br	H	Me	Bu-t	150-152
C- 53	4-Br	H	Et	Et	97- 99
C- 54	4-I	H	Me	Pr-i	116-118
C- 55	4-I	H	Me	Pr-i	120-122
C- 56	4-I	H	Me	Pr-i	95- 98

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 12

2) Но соеди- нения	Xп	Y	R ³	R ⁴	Точка плавл. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _d ²⁰)
C- 57	3,5-Cl ₂	H	Me	Pr-i	127-130
C- 58	4-Me	H	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH=CH ₂	
C- 59	4-Me	H	-(CH ₂) ₄ -		
C- 60	4-Me	H	Me	Pr-n	
C- 61	4-Me	H	Me	Pen-cyc	
C- 62	4-Me	H	Me	Pr-i	136-137
C- 63	4-Me	H	Me	Pr-i	102-103
C- 64	4-Me	H	Me	Pr-i	89- 90
C- 65	4-Me	H	Me	Bu-s	
C- 66	4-Me	H	Me	Bu-t	94- 97
C- 67	4-Me	H	Me	Bu-t	103-105
C- 68	4-Me	H	Et	Et	99-103
C- 69	4-Me	H	Et	Pr-n	
C- 70	4-Me	H	Et	Pr-i	134-137
C- 71	4-Et	H	Me	Pr-i	122-123
C- 72	4-Et	H	Me	Pr-i	109-110
C- 73	4-Pr-i	H	Me	Pr-i	109-111
C- 74	4-Pr-i	H	Me	Pr-i	101-102
C- 75	4-Bu-i	H	Me	Pr-i	110-111
C- 76	4-Bu-i	H	Me	Pr-i	84- 85
C- 77	4-Bu-t	H	-(CH ₂) ₆ -		
C- 78	4-Bu-t	H	Me	Et	
C- 79	4-Bu-t	H	Me	Pr-n	
C- 80	4-Bu-t	H	Me	Pr-cyc	
C- 81	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	136-137
C- 82	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	140-141
C- 83	4-Bu-t	H	Me	CF ₃	
C- 84	4-Bu-t	H	Me	Bu-s	
C- 85	4-Bu-t	H	Me	Bu-i	
C- 86	4-Bu-t	H	Me	Bu-t	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 13

2) Но соеди- нения	X _n	Y	R ³	R ⁴	Точка плавл. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _D ²⁰)
C- 87	4-Et	H	Et	Et	70- 72
C- 88	4-Et	H	Me	Bu-t	101-103
C- 89	4-Et	H	Me	Bu-t	102-103
C- 90	4-CF ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		
C- 91	4-CF ₃	H	Me	Et	
C- 92	4-CF ₃	H	Me	Pr-cyc	92- 94
C- 93	4-CF ₃	H	Me	Pr-cyc	114-117
C- 94	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	121-124
C- 95	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	126-127
C- 96	4-CF ₃	H	Me	CHCl ₂	
C- 97	4-CF ₃	H	Me	Bu-s	90-93
C- 98	4-CF ₃	H	Me	Bu-i	
C- 99	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	120-121
C-100	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	163-164
C-101	4-CF ₃	H	Et	Et	87- 88
C-102	4-CF ₃	H	Et	Pr-i	100-103
C-103	4-CF ₃	H	Et	Pr-i	106-107
C-104	4-CH ₂ Ph	H	Me	Pr-i	
C-105	4-OH	H	Me	Pr-i	
C-106	4-OMe	H	Me	Pr-i	108-109
C-107	4-OMe	H	Me	Pr-i	99-100
C-108	4-OEt	H	Me	Pr-i	93- 94
C-109	4-OEt	H	Me	Pr-i	112-113
C-110	4-OPr-i	H	Me	Pr-n	
C-111	4-OPr-i	H	-(CH ₂) ₅ -		
C-112	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	111-112
C-113	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	128-129
C-114	4-OCHF ₂	H	Me	Pr-i	74- 80
C-115	4-OCHF ₂	H	Me	Pr-i	98-102
C-116	4-OCHF ₂	H	Et	Et	1. 4959

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

Таблица 14

2) No соеди- нения	Xn	Y	R ³	R ⁴	Точка плавн. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _D ²⁰)
C-117	4-OCH ₂ CF ₃	H	Me	Pr-i	68- 70
C-118	4-OCH ₂ CF ₃	H	Me	Pr-i	98-101
C-119	4-OPr-i	H	Et	Et	90- 93
C-120	4-OPr-n	H	Me	Pr-i	105-107
C-121	4-OPen-сyc	H	Me	Pr-i	108-110
C-122	4-OCF ₃	H	Me	Pr-i	97-98
C-123	4-OCF ₃	H	Me	Pr-i	122-124
C-124	4-OCF ₃	H	Me	CF ₃	
C-125	4-OCF ₃	H	Et	Et	1. 4776
C-126	4-OCF ₃	H	Me	Bu-t	
C-127	3. 4- (OMe) ₂	H	Me	Pr-i	
C-128	3. 4. 5- (OMe) ₃	H	Me	Pr-i	
C-129	4-OPh	H	Me	Pr-i	120-122
C-130	4-OPh	H	Me	Pr-i	129-131
C-131	4-SMe	H	Me	Pr-i	90- 93
C-132	4-S(O)Me	H	Me	Bu-t	
C-133	4-SPr-i	H	Et	Et	
C-134	4-SPh	H	Me	Pr-i	
C-135	4-SO ₂ Me	H	Me	Pr-i	
C-136	4-SO ₂ Ph	H	Me	Pr-i	
C-137	4-NH ₂	H	Me	Pr-i	1. 5364
C-138	4-N(Me) ₂	H	Me	Pr-i	
C-139	4-NHPr-i	H	Me	Pr-i	
C-140	4-Ph	H	Me	Pr-i	142-143
C-141	4-Ph	H	Me	Pr-i	149-150
C-142	4-Ph	H	Et	Et	
C-143	4-Ph	H	Me	Bu-s	
C-144	4-Ph	H	Me	Bu-t	
C-145	4-OPh(2-Cl)	H	Me	Pr-i	
C-146	4-CH ₂ Ph(3-Cl)	H	Me	Pr-i	

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

Таблица 15

2) No соеди- нения	X _n	Y	R ³	R ⁴	Точка плавл. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _d ²⁰)
C-147	4-Ph(4-Cl)	H	Me	Pr-i	
C-148	4-Ph(2-Me)	H	Me	Pr-i	
C-149	4-OPh(3-Me)	H	Me	Pr-i	
C-150	4-CH ₂ Ph(4-Me)	H	Me	Pr-i	
C-151	4-CH ₂ Ph(2-OMe)	H	Me	Pr-i	
C-152	4-Ph(3-OMe)	H	Me	Pr-i	
C-153	4-OPh(4-OMe)	H	Me	Pr-i	
C-154	4-(2-Py)	H	Me	Pr-i	
C-155	4-(3-Py)	H	Me	Pr-i	
C-156	4-(4-Py)	H	Me	Pr-i	
C-157	4-CN	H	Me	Pr-i	148-149
C-158	4-CN	H	Me	Pr-i	124-125
C-159	4-NO ₂	H	Me	Pr-i	121-123
C-160	4-COMe	H	Me	Pr-i	
C-161	4-COPh	H	Me	Pr-i	105-108
C-162	4-COPh	H	Me	Pr-i	154-157
C-163	4-COPh(3-Me)	H	Me	Pr-i	
C-164	4-COPh(4-Cl)	H	Me	Pr-i	
C-165	4-CO(2-Thi)	H	Me	Pr-i	144-146
C-166	4-CO(2-Thi)	H	Me	Pr-i	115-117
C-167	4-CO ₂ Me	H	Me	Pr-i	
C-168	4-CO ₂ Pr-i	H	Me	Pr-i	
C-169	3, 4-Cl ₂	H	Me	Pr-i	100-102
C-170	3, 4-Cl ₂	H	Me	Pr-i	171-173
C-171	3, 4-Cl ₂	H	Me	Bu-t	134-136
C-172	3, 4-Cl ₂	H	Me	Bu-t	157-158
C-173	3, 4-Cl ₂	H	Et	Et	61- 63
C-174	3-Cl, 4-OMe	H	Me	Pr-i	1.5260
C-175	3-Cl, 4-OMe	H	Me	Pr-i	125-127
C-176	3-Cl, 4-OMe	H	Me	Pr-i	88- 90

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

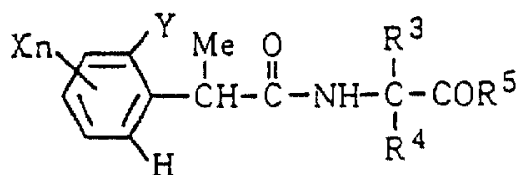
Таблица 16

2) No соединения	Xn	Y	R ³	R ⁴	Точка плавл. (°C) или показатель преломления (n _d ²⁰)
C-177	3, 4-(Me) ₂	H	Me	Pr-i	100-101
C-178	3, 4-(Me) ₂	H	Me	Pr-i	128-130
C-179	3, 4-(Me) ₂	H	Me	Bu-t	67- 69
C-180	3, 4-(Me) ₂	H	Me	Bu-t	100-101
C-181	4-C≡CMe	H	Me	Pr-i	106-108
C-182	4-C≡CMe	H	Me	Pr-i	78- 80
C-183	4-CH=CH ₂	H	Me	Pr-i	
C-184	4-SMe	H	Me	Bu-t	91- 94
C-185	4-SMe	H	Me	Bu-t	108-110
C-186	4-SMe	H	Et	Et	77- 78
C-187	4-I	H	Me	Bu-t	129-130
C-188	4-I	H	Me	Bu-t	132-133
C-189	4-I	H	Me	Pr-cyc	118-120
C-190	4-I	H	Me	Pr-cyc	142-144
C-191	4-I	H	Et	Et	105-108
C-192	4-OCF ₃	H	Me	Bu-t	116-119
C-193	4-(1-Pyrr)	H	Me	Pr-i	119-120
C-194	4-(1-Pyrr)	H	Me	Pr-i	156-158
C-195	4-(1-Pyrr)	H	Me	Pr-i	123-125
C-196	4-Cl	H	Me	Pr-i	102-104
C-197	4-Cl	H	Me	Pr-i	120-121
C-198	4-Cl	H	Me	Pr-i	107-109
C-199	4-Cl	H	Me	Pr-i	121-122
C-200	4-OMe	H	Me	Bu-t	l. 5219
C-201	4-OMe	H	Me	Bu-t	88- 90
C-202	4-OMe	H	Me	Bu-t	67- 68

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

Таблица 17



2) No соеди- нения	Xn	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D- 1	-	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 2	-	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 3	-	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 4	-	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 5	-	F	Me	Pr-i	OMe	
D- 6	-	Cl	Me	Pr-i	OMe	
D- 7	4-Cl	F	Me	Pr-i	OMe	
D- 8	4-Cl	Cl	Me	Pr-i	OMe	
D- 9	3-Me	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 10	3-Me	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 11	3-Me	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 12	3-Me	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 13	3-Cl	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 14	3-Cl	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 15	3-Cl	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 16	3-Cl	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 17	3-NO ₂	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 18	4-F	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 19	4-Cl	H	Me	Pr-i	OMe	120-123
D- 20	4-Cl	H	Me	Pr-i	OEt	115-118
D- 21	4-Cl	H	Me	Pr-i	OPr-i	124-126
D- 22	4-Cl	H	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
D- 23	4-Cl	H	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
D- 24	4-Cl	H	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
D- 25	4-Cl	H	Me	Pr-i	Me	140-143
D- 26	4-Cl	H	Me	Pr-i	NH ₂	136-137

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 18

2) No соеди- нения	Xn	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D- 27	4-Cl	H	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
D- 28	4-Cl	H	Et	Et	OMe	98- 99
D- 29	4-Cl	H	Et	Et	OEt	85- 87
D- 30	4-Cl	H	Et	Et	OPr-i	
D- 31	4-Cl	H	Et	Et	Me	(112-116
D- 32	4-Cl	H	Et	Et	NH ₂	116-118
D- 33	4-Cl	H	Et	Et	N(Me) ₂	
D- 34	4-Cl	H	Me	Bu-t	OMe	122-123
D- 35	4-Cl	H	Me	Bu-t	OEt	
D- 36	4-Cl	H	Me	Bu-t	OPr-i	
D- 37	4-Cl	H	Me	Bu-t	Me	
D- 38	4-Cl	H	Me	Bu-t	NH ₂	
D- 39	4-Br	H	Me	Pr-i	OMe	124-126
D- 40	4-Br	H	Me	Pr-i	OEt	92-94
D- 41	4-Br	H	Me	Pr-i	OEt	140-142
D- 42	4-Br	H	Me	Pr-i	NH ₂	132-134
D- 43	4-Br	H	Me	Bu-s	OMe	
D- 44	4-Me	H	Me	Pr-i	OMe	76- 77
D- 45	4-Me	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 46	4-Me	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 47	4-Me	H	Me	Pr-i	OCH ₂ Ph	
D- 48	4-Me	Cl	Me	Pr-i	OMe	
D- 49	4-Me	H	Me	Pr-i	OPen-cyc	
D- 50	4-Me	H	Me	Pr-i	Me	94-96
D- 51	4-Me	H	Me	Pr-i	NH ₂	140-146
D- 52	4-Me	H	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
D- 53	4-Me	H	Et	Et	OMe	
D- 54	4-Me	H	Et	Et	OEt	
D- 55	4-Me	H	Et	Et	OPr-i	
D- 56	4-Me	H	Et	Et	Me	(120-121

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

RU 2 1 5 6 2 3 5 C 2

Таблица 19

2) Но соеди- нения	Xn	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D- 57	4-Me	H	Et	Et	NH ₂	
D- 58	4-Me	H	Et	Et	N(Pr-n) ₂	
D- 59	4-Br	H	Me	Bu-t	OMe	127-128
D- 60	4-Br	H	Et	Et	OMe	
D- 61	4-Br	H	Et	Et	OEt	
D- 62	4-Br	H	Et	Et	OPr-i	
D- 63	4-Et	H	Me	Pr-i	OMe	82- 83
D- 64	4-Et	H	Me	Pr-i	OMe	101-102
D- 65	4-Et	H	Me	Pr-i	OMe	96- 98
D- 66	4-Pr-i	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 67	4-Pr-i	H	Me	Pr-i	Pr-i	
D- 68	4-Pr-i	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 69	4-Pr-i	H	Et	Et	OMe	
D- 70	4-Pr-i	H	Et	Et	OEt	
D- 71	4-Pr-i	H	Et	Et	OPr-i	
D- 72	4-Pr-i	H	Et	Et	NH ₂	
D- 73	4-I	H	Me	Pr-i	OMe	121-124
D- 74	4-I	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 75	4-I	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 76	4-I	H	Me	Bu-t	OMe	132-134
D- 77	4-I	H	Et	Et	OMe	
D- 78	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 79	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	OEt	
D- 80	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 81	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
D- 82	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	Me	
D- 83	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 84	4-Bu-t	H	Me	Pr-i	N(Me) ₂	
D- 85	4-Bu-t	H	Et	Et	OMe	
D- 86	4-Bu-t	H	Et	Et	OPr-i	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 20

2) No сосди- нения	Xп	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D- 87	4-Bu-t	H	Et	Et	Me	
D- 88	4-Bu-t	H	Et	Et	NH ₂	
D- 89	4-CH=CHMe	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 90	4-C≡CMe	H	Me	Pr-i	OMe	
D- 91	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OMe	128-129
D- 92	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OMe	159-160
D- 93	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OEt	89- 91
D- 94	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D- 95	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂	
D- 96	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OCH ₂ C≡CH	
D- 97	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	Me	137-140
D- 98	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D- 99	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	N(Me) ₂	187-190
D-100	4-CF ₃	H	Et	Et	OMe	
D-101	4-CF ₃	H	Et	Et	OEt	
D-102	4-CF ₃	H	Et	Et	OPr-i	
D-103	4-CF ₃	H	Et	Et	OCH ₂ Ph	
D-104	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	OH	136-139
D-105	4-CF ₃	H	Me	Pr-i	NHMe	150-152
D-106	4-CF ₃	H	Et	Et	N(Me) ₂	
D-107	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	OMe	
D-108	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	OEt	
D-109	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	Me	155-158
D-110	4-CF ₃	H	Me	Bu-t	NH ₂	
D-111	4-OMe	H	Me	Pr-i	OMe	
D-112	4-OMe	H	Me	Pr-i	OEt	
D-113	4-OMe	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D-114	4-OMe	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D-115	4-OMe	H	Et	Et	OMe	
D-116	4-OMe	H	Et	Et	OEt	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 21

2) Но соеди- нения	Xп	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D-117	4-OMe	H	Et	Et	OPr-i	
D-118	4-OMe	H	Et	Et	NH ₂	
D-119	4-OCF ₃	H	Me	Pr-i	OMe	95- 96
D-120	4-OCF ₃	H	Me	Pr-i	OMe	156-158
D-121	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	OMe	
D-122	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	OEt	
D-123	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D-124	4-OPr-i	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D-125	4-OPr-i	H	Et	Et	OMe	
D-126	4-OCF ₃	H	Et	Et	OMe	
D-127	4-OPr-i	H	Et	Et	OPr-i	
D-128	4-OPr-i	H	Et	Et	NH ₂	
D-129	4-OCHF ₂	H	Me	Pr-i	OMe	
D-130	4-OCHF ₂	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D-131	4-Ph	H	Me	Pr-i	OMe	
D-132	4-Ph	H	Me	Pr-i	OEt	
D-133	4-Ph	H	Me	Pr-i	OPr-i	
D-134	4-Ph	H	Me	Pr-i	NH ₂	
D-135	4-SPh (2-Cl)	H	Et	Et	OMe	
D-136	4-S(O)Ph (2-Cl)	H	Et	Et	OMe	
D-137	4-SO ₂ Ph (2-Cl)	H	Et	Et	OMe	
D-138	4-SPh (3-CF ₃)	H	Me	Bu-t	OMe	
D-139	4-S(O)Ph (3-CF ₃)	H	Me	Bu-t	OMe	
D-140	4-SO ₂ Ph (3-CF ₃)	H	Me	Bu-t	OMe	
D-141	4-SPh (4-Me)	H	Me	Pr-i	OMe	
D-142	4-S(O)Ph (4-Me)	H	Me	Pr-i	OMe	
D-143	4-SO ₂ Ph (4-Me)	H	Me	Pr-i	OMe	
D-144	4-NO ₂	H	Et	Et	OMe	
D-145	4-SMe	H	Me	Pr-i	OMe	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

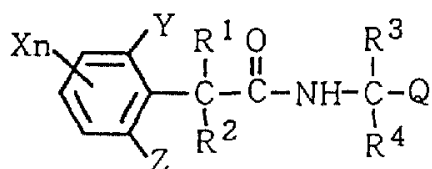
Таблица 22

2) Но соеди- нения	Xп	Y	R ³	R ⁴	R ⁵	3) Точка плавления (°C)
D-146	3,4-Cl ₂	H	Me	Pr-i	OMe	
D-147	3,4-Cl ₂	H	Me	Bu-t	OMe	
D-148	3,4-Cl ₂	H	Et	Et	OMe	
D-149	3,4-Cl ₂	H	Me	Bu-t	NH ₂	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 23



2) No соеди- нения	Xn	Y	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Q	Точка плавп. (°C) или пока- затель прелом- ления (n _d ²⁰)
E- 1	-	H	H	Me	Me	Et	Et	CN	
E- 2	-	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 3	-	H	H	Me	Me	Me	Bu-t	CN	
E- 4	3-Me	H	H	Me	Me	Et	Et	CN	
E- 5	3-Me	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 6	3-Me	H	H	Me	Me	Me	Bu-t	CN	
E- 7	4-Cl	H	H	Me	Me	Me	Me	CN	105-106
E- 8	4-Cl	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	87- 89
E- 9	4-Cl	H	H	Me	Me	Me	Pr-cyc	CN	93- 94
E- 10	4-CF ₃	H	H	Me	Me	Et	Et	CN	
E- 11	4-CF ₃	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	107-108
E- 12	4-CF ₃	H	H	Me	Me	Me	Bu-t	CN	
E- 13	4-Bu-t	H	H	Me	Me	Me	Et	CN	
E- 14	4-Bu-t	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 15	4-Bu-t	H	H	Me	Me	Me	Bu-t	CN	
E- 16	4-Ph	H	H	Me	Me	Et	Et	CN	
E- 17	4-Ph	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 18	4-Me	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CN	1.5116
E- 19	4-Cl	H	H	Me	Me	Et	Et	CO ₂ Me	
E- 20	4-Cl	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 21	4-Cl	Cl	H	Me	Me	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 22	4-CF ₃	H	H	Me	Me	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 23	4-CF ₃	H	H	Me	Me	Me	Bu-t	CO ₂ Me	
E- 24	-	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	
E- 25	-	H	H	H	Pr-cyc	Me	Pr-i	CN	
E- 26	-	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 24

2) Но соеди- нения	X n	Y	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Q	3) Точка плавления (°C)
E- 27	3-Cl	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	
E- 28	3-Cl	H	H	H	Pr-сус	Me	Pr-i	CN	
E- 29	3-Cl	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	
E- 30	4-Cl	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	120-122
E- 31	4-Cl	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	108-110
E- 32	4-Cl	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	141-144
E- 33	4-Cl	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-сус	CN	141-142
E- 34	4-Cl	H	H	H	Pr-i	Me	Me	CN	143-145
E- 35	4-Cl	H	H	H	CH ₂ F	Me	Pr-i	CN	
E- 36	4-Cl	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 37	4-CF ₃	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	132-134
E- 38	4-CF ₃	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	109-111
E- 39	4-CF ₃	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	
E- 40	4-CF ₃	H	H	H	CH ₂ F	Me	Pr-i	CN	
E- 41	4-CF ₃	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 42	4-Bu-t	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CN	
E- 43	4-Bu-t	H	H	H	Pr-сус	Me	Pr-i	CN	
E- 44	4-Bu-t	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	
E- 45	4-Bu-t	H	H	H	CH ₂ F	Me	Pr-i	CN	
E- 46	4-Bu-t	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 47	4-Me	H	H	Pr-n	Pr-n	Me	Pr-i	CN	
E- 48	4-Me	H	H	H	Pr-сус	Me	Pr-i	CN	
E- 49	4-Me	H	H	H	Pr-i	Me	Pr-i	CN	
E- 50	4-Me	H	H	H	CF ₃	Me	Pr-i	CN	
E- 51	4-Me	H	H	H	Et	Me	Pr-i	CO ₂ Me	
E- 52	4-Cl	F	F	H	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 53	4-Cl	Cl	Cl	H	Me	Me	Pr-i	CN	
E- 54	4-OMe	H	H	H	CHF ₂	Me	Pr-i	CN	

Таблица 25:

Оценка	Подавляющая активность
A	100%
B	80% или больше и меньше, чем 100%
C	50% или больше и меньше, чем 80%
D	меньше, чем 50%

Таблица 26

№ соединения	Оценка	№ соединения	Оценка
A-2	A	A-87	A
A-4	A	A-92	A
A-6	A	A-104	A
A-8	A	A-105	A
A-9	B	A-107	A
A-10	A	A-117	B
A-15	A	B-6	A
A-19	B	B-7	A
A-20	A	B-8	A
A-23	A	B-13	B
A-26	A	B-15	A
A-30	A	B-34	A
A-31	A	B-35	A
A-33	A	B-36	A
A-34	A	B-41	B
A-35	A	B-116	A
A-41	A	B-140	A
A-52	A	C-1	B
A-54	A	C-2	B
A-56	A	C-3	A
A-57	A	C-12	A
A-60	A	C-13	A
A-61	A	C-16	A
A-62	A	C-17	A
A-63	A	C-18	A
A-64	A	C-19	A
A-68	A	C-21	B
A-71	B	C-22	B
A-74	B	C-24	A
A-75	B	C-25	A
A-76	A	C-27	A
A-78	B	C-28	A
A-81	A	C-29	A
A-82	B	C-30	A
A-86	A	C-31	A

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 27

№ соединения	Оценка	№ соединения	Оценка
С-32	A	С-81	A
С-33	A	С-82	A
С-34	A	С-87	A
С-35	A	С-88	A
С-37	A	С-89	B
С-38	A	С-92	A
С-39	A	С-93	A
С-40	A	С-94	A
С-41	A	С-95	A
С-42	A	С-97	A
С-43	A	С-99	A
С-44	A	С-100	A
С-47	A	С-101	A
С-48	A	С-102	A
С-49	A	С-103	A
С-51	A	С-106	A
С-52	A	С-107	B
С-53	A	С-108	A
С-54	A	С-109	A
С-55	A	С-112	A
С-56	A	С-113	B
С-57	A	С-114	A
С-62	A	С-115	B
С-63	A	С-116	A
С-64	A	С-117	B
С-66	B	С-118	B
С-67	A	С-119	B
С-68	A	С-120	A
С-70	B	С-121	A
С-71	A	С-122	A
С-72	A	С-123	A
С-73	A	С-125	A
С-74	A	С-129	A
С-75	A	С-130	A
С-76	B	С-131	A

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 28

Но соединения	Оценка	Но соединения	Оценка
C-137	A	C-195	B
C-140	A	C-196	A
C-141	B	C-197	A
C-157	A	C-198	A
C-158	A	C-199	A
C-159	A	C-200	B
C-161	A	C-201	B
C-162	A	C-202	B
C-165	A	D-19	A
C-166	A	D-20	A
C-169	A	D-21	A
C-170	B	D-25	A
C-171	A	D-26	A
C-172	A	D-28	A
C-173	A	D-29	A
C-174	A	D-31	A
C-175	A	D-32	A
C-176	A	D-34	B
C-177	A	D-39	A
C-178	A	D-40	A
C-179	A	D-41	A
C-180	B	D-42	A
C-181	A	D-50	A
C-182	A	D-56	A
C-184	B	D-59	B
C-185	B	D-63	B
C-186	B	D-64	A
C-187	A	D-65	B
C-188	B	D-73	A
C-189	A	D-76	B
C-190	A	D-91	A
C-191	A	D-92	A
C-192	B	D-97	A
C-193	B	D-99	B
C-194	B	D-104	B

RU 2156235 C2

RU ?156235 C2

Таблица 28-1

Но соединения	Оценка
D-109	A
D-105	B
D-119	A
D-120	B
E-7	B
E-8	B
E-9	A
E-11	B
E-18	A
E-32	B
E-33	A
E-34	A
E-37	B
E-38	B

RU 2156235 C2

RU ?156235 C2

Таблица 29

№ соединения	Оценка	№ соединения	Оценка
A-4	A	C-57	A
A-6	A	C-62	A
A-15	A	C-64	A
A-19	A	C-66	B
A-20	A	C-92	A
A-23	A	C-93	B
A-26	B	C-94	A
A-41	A	C-95	B
A-52	A	C-97	B
A-54	A	C-102	B
A-56	A	C-103	B
A-71	A	C-114	A
A-76	A	C-116	B
A-117	B	C-119	B
B-6	A	C-169	A
B-13	A	C-170	A
B-15	B	C-171	A
B-34	A	C-172	A
C-1	A	C-176	A
C-2	A	C-177	A
C-3	A	C-178	A
C-12	A	C-187	A
C-13	A	C-189	B
C-16	B	C-192	B
C-17	B	C-196	A
C-21	B	C-197	B
C-29	A	C-198	B
C-33	A	C-199	B
C-37	A	D-25	A
C-39	A	D-31	A
C-40	A	D-76	B
C-41	A	D-97	A
C-44	B	E-7	A
C-49	A	E-18	A
C-56	A	Сравнительное соединение	D

RU 2156235 C2

RU ?156235 C2

Таблица 30

Индекс заболеваемости	Инфицированная площадь
0	Нет повреждений
1	Меньше, чем 5%
2	5% или больше и меньше, чем 33,3%
3	33,3% или больше и меньше, чем 66,6%
4	66,6% или больше

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2

Таблица 31

№ соединения	Оценка
A-20	A
A-26	B
A-62	A
A-63	A
A-64	A
A-76	B
A-104	A
A-105	A
A-117	B
B-6	A
C-18	A
C-37	B
C-54	A
C-55	A
C-73	A
C-75	A
C-140	A
C-141	A
C-174	B
C-175	B
C-177	A
C-178	A
C-196	B
C-198	B
C-200	B
C-201	B
C-202	A
D-76	A
D-91	A
D-92	A
Сравнительное соединение	D

RU 2156235 C2

RU 2156235 C2