



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2003136089/04, 14.05.2002

(30) Приоритет: 15.05.2001 US 60/290,884

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2005 Бюл. № 11

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 15.12.2003

(86) Заявка РСТ:
US 02/18394 (14.05.2002)

(87) Публикация РСТ:
WO 02/09183 (21.11.2002)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры",
пат.пов. Г.Б. Егоровой

(71) Заявитель(и):
Е.И.ДЮПОН ДЕ НЕМУР ЭНД КОМПАНИ (US)

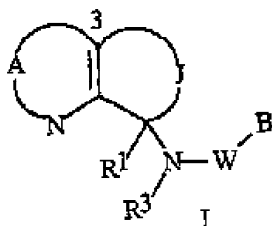
(72) Автор(ы):
СОНГ Йинг (US)

(74) Патентный поверенный:
Егорова Галина Борисовна

(54) **КОНДЕНСИРОВАННЫЕ С ПИРИДИНИЛОМ БИЦИКЛИЧЕСКИЕ АМИДЫ В КАЧЕСТВЕ
ФУНГИЦИДОВ**

Формула изобретения

1. Способ борьбы с заболеваниями растений, вызываемыми грибковыми патогенами растений, включающий нанесение на растение, или его часть, или на семена растений, или саженцы фунгицидно эффективного количества соединения формулы I, его N-оксидов, приемлемых в сельском хозяйстве солей и композиций



где A вместе с N-C=C образуют замещенное конденсированное пиридиныльное кольцо;

B является замещенным фенильным или пиридиныльным кольцом;

J является необязательно замещенной связующей цепью, содержащей от 2 до 5 составляющих, включая, по крайней мере, одну углеродную составляющую, необязательно включающую одну или две углеродных составляющих в виде C(=O) и, необязательно, включающую одну составляющую, выбранную из азота и кислорода;

W является C=L или SO_n;

L является O или S;

R¹ является H или C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом или

C₃-C₆ циклоалкилом, каждый из которых необязательно замещен;

R³ является H или C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом или C₃-C₆ циклоалкилом, C₂-C₆ алкилкарбонилем, C₂-C₆ алкоксикарбонилем, C₂-C₆ алкиламинокарбонилем или C₃-C₈ диалкиламинокарбонилем; и n равно 1 или 2.

2. Способ по п.1, где А вместе с N-C=C образуют конденсированное пиридиноподобное кольцо, замещенное одним или двумя заместителями, независимо выбранными из R⁵; В замещен от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R⁶; J является связующей цепью, содержащей от 2 до 5 составляющих, включающих, по крайней мере, одну углеродную составляющую, необязательно включающую от одного до двух углеродных составляющих в виде C(=O) и необязательно включающую одну составляющую, выбранную из азота и кислорода, необязательно замещенную одним или более заместителями, выбранными из группы, включающей C₁-C₂ алкил, галоген, CN, NO₂ и C₁-C₂ алкокси; R¹ является H или C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом или C₃-C₆ циклоалкилом, каждый из которых необязательно замещен одним или более заместителями, выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂, гидроксильную, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино и C₃-C₆ циклоалкиламино; каждый R⁵ и каждый R⁶ независимо являются C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₆ галогеналкилом, C₂-C₆ галогеналкенилом, C₂-C₆ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂, гидроксильной, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинилом, C₁-C₄ галогеналкилсульфонилом, C₁-C₄ алкоксикарбонилем, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкилкарбонилем, C₂-C₆ алкоксикарбонилем, C₂-C₆ алкиламинокарбонилем, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилем, C₃-C₆ триалкилсилилол; или каждый R⁵ и каждый R⁶ независимо являются фенильным кольцом, 5- или 6-составляющим гетероароматическим кольцом, бензильным кольцом или феноксильным кольцом, где каждое кольцо необязательно замещено от одной до трех группами, независимо выбранными из R⁷; и каждый R⁷ независимо является C₁-C₄ алкилом, C₂-C₄ алкенилом, C₂-C₄ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₄ галогеналкилом, C₂-C₄ галогеналкенилом, C₂-C₄ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ алкоксикарбонилем, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонилем, C₂-C₆ алкоксикарбонилем, C₂-C₆ алкиламинокарбонилем, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилем или C₃-C₆ триалкилсилилол.

3. Способ по п.2, где W является C=O; J выбирают из -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -OCH₂-, -OCH₂CH₂-, -OCH₂CH₂CH₂-, -CH₂NHCH₂-, -CH₂N(C₁-C₂ алкил)CH₂-, -CONHCO- и -CON(C₁-C₂ алкил)CO-; и каждый R⁵ и каждый R⁶ независимо являются C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₆ галогеналкилом, C₂-C₆ галогеналкенилом, C₂-C₆ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинилом, C₁-C₄ галогеналкилсульфонилом, C₁-C₄ алкоксикарбонилем, C₂-C₆ алкилкарбонилем, C₂-C₆ алкоксикарбонилем, C₂-C₆ алкиламинокарбонилем или C₃-C₈ диалкиламинокарбонилем.

4. Способ по п.3, где В является фенильным кольцом, необязательно замещенным от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R⁶; J является -CH₂CH₂- или -CH₂CH₂CH₂-; каждый R⁵ независимо является CH₃, Cl, Br, I, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, SCF₃, SCHF₂, CO₂CH₃ или CONHCH₃; и каждый R⁶ независимо является C₁-C₂ алкилом,

C₁-C₂ галогеналкилом, галогеном, CN, C₁-C₂ алкокси, C₁-C₂ галогеналкокси, C₁-C₂ алкилтио, C₁-C₂ алкилсульфинилом или C₁-C₂ алкилсульфонилом и, по крайней мере, один R⁶ расположен в положении орто к связи с W.

5. Способ по п.3, где В является 3-пиридиныльным или 4-пиридиныльным кольцом, необязательно замещенным от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R⁶; J является -CH₂CH₂- или -CH₂CH₂CH₂-; каждый R⁵ независимо является CH₃, Cl, Br, I, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, SCF₃, SCHF₂, CO₂CH₃ или CONHCH₃ и каждый R⁶ независимо является C₁-C₂ алкилом, C₁-C₂ галогеналкилом, галогеном, CN, C₁-C₂ алкокси, C₁-C₂ галогеналкокси, C₁-C₂ алкилтио, C₁-C₂ алкилсульфинилом или C₁-C₂ алкилсульфонилом и, по крайней мере, один R⁶ расположен в положении орто к связи с W.

6. Способ по п.5, где В является 3-пиридиныльным кольцом, в котором один R⁶ является Cl, расположенным в положении 2 орто к связи с C=O, другой R⁶ выбирают из Cl или метила и он расположен в положении 4 орто к связи с C=O, и третий необязательный R⁶ является метилом в положении 6.

7. Способ по любому из пп.1-6, где R¹ является водородом и R³ является водородом.

8. Способ по п.1, включающий соединение, выбранное из группы, состоящей из 2-хлор-6-метокси-N-(5,6,7,8-тетрагидро-3-метил-8-хинолинил)-4-пиридинкарбоксамиды, 2,6-дихлор-N-(5,6,7,8-тетрагидро-3-метил-8-хинолинил)бензамида и 2,3,6-трифтор-N-(5,6,7,8-тетрагидро-3-метил-8-хинолинил)бензамида.

9. Соединение формулы I по п.1, его N-оксиды, приемлемые в сельском хозяйстве соли при условии, что если В является замещенным фенильным кольцом, W является C=O или SO₂, R³ является H и J является обогащенной цепью, содержащей от 2 до 4 атомов углерода, которые либо замещены, либо незамещены от одного до трех заместителями, выбранными из группы, включающей алкил, алкокси, арил или аралкил, то соединение является N-оксидом.

10. Соединение по п.9, где А вместе с N-C=C образуют конденсированное пиридиныльное кольцо, замещенного одним или двумя заместителями, независимо выбранными из R⁵; В замещен от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R⁶; J является связующей цепью, содержащей от 2 до 5 составляющих, включающую, по крайней мере, одну углеродную составляющую, необязательно включающую от одной до двух углеродных составляющих в виде C(=O) и необязательно включающую одну составляющую, выбранную из азота и кислорода, необязательно замещенную одним или более заместителями, выбранными из группы, включающей C₁-C₂ алкил, галоген, CN, NO₂ и C₁-C₂ алкокси; R¹ является H или C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом или C₃-C₆ циклоалкилом, каждый из которых необязательно замещен одним или более заместителями, выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂, гидроксид, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино и C₃-C₆ циклоалкиламино; каждый R⁵ и каждый R⁶ независимо являются C₁-C₆ алкилом, C₂-C₆ алкенилом, C₂-C₆ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₆ галогеналкилом, C₂-C₆ галогеналкенилом, C₂-C₆ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂, гидроксид, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинилом, C₁-C₄ галогеналкилсульфонилом, C₁-C₄ алкоксикарбонилом, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкилкарбонилом, C₂-C₆ алкоксикарбонилом, C₂-C₆ алкиламинокарбонилом, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилом, C₃-C₆ триалкилсилилом или каждый R⁵ и каждый R⁶ независимо являются фенильным кольцом, 5- или 6-составляющим гетероароматическим кольцом, бензильным кольцом или фенокси кольцом, где каждое кольцо необязательно замещено от одной до трех группами, независимо выбранными из R⁷; и каждый R⁷ независимо является C₁-C₄ алкилом,

C_2-C_4 алкенилом, C_2-C_4 алкинилом, C_3-C_6 циклоалкилом, C_1-C_4 галогеналкилом, C_2-C_4 галогеналкенилом, C_2-C_4 галогеналкинилом, C_3-C_6 галогенциклоалкилом, галогеном, CN, NO_2 , C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 галогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинилом, C_1-C_4 алкилсульфонилом, C_1-C_4 алкоксикарбонилом, C_1-C_4 алкиламино, C_2-C_8 диалкиламино, C_3-C_6 циклоалкиламино, C_3-C_6 (алкил)циклоалкиламино, C_2-C_4 алкилкарбонилом, C_2-C_6 алкоксикарбонилом, C_2-C_6 алкиламинокарбонилом, C_3-C_8 диалкиламинокарбонилом или C_3-C_6 триалкилсилилом.

11. Соединение по п.10, в котором W является $C=O$; J выбирают из $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-OCH_2-$, $-OCH_2CH_2-$, $-OCH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2NHCH_2-$, $-CH_2N(C_1-C_2 \text{ алкил})CH_2-$, $-CONHCO-$ и $-CON(C_1-C_2 \text{ алкил})CO-$ и каждый R^5 и каждый R^6 независимо являются C_1-C_6 алкилом, C_2-C_6 алкенилом, C_2-C_6 алкинилом, C_3-C_6 циклоалкилом, C_1-C_6 галогеналкилом, C_2-C_6 галогеналкенилом, C_2-C_6 галогеналкинилом, C_3-C_6 галогенциклоалкилом, галогеном, CN, NO_2 , C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 галогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинилом, C_1-C_4 алкилсульфонилом, C_1-C_4 галогеналкилтио, C_1-C_4 галогеналкилсульфинилом, C_1-C_4 галогеналкилсульфонилом, C_1-C_4 алкоксикарбонилом, C_2-C_6 алкилкарбонилом, C_2-C_6 алкоксикарбонилом, C_2-C_6 алкиламинокарбонилом или C_3-C_8 диалкиламинокарбонилом.

12. Соединение по п.11, в котором В является фенильным кольцом, необязательно замещенным от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R^6 ; J является $-CH_2CH_2-$ или $-CH_2CH_2CH_2-$; каждый R^5 независимо является CH_3 , Cl, Br, I, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, SCF_3 , $SCHF_2$, CO_2CH_3 или $CONHCH_3$ и каждый R^6 независимо является C_1-C_2 алкилом, C_1-C_2 галогеналкилом, галогеном, CN, C_1-C_2 алкокси, C_1-C_2 галогеналкокси, C_1-C_2 алкилтио, C_1-C_2 алкилсульфинилом или C_1-C_2 алкилсульфонилом и, по крайней мере, один R^6 расположен в положении орто к связи с W.

13. Соединение по п.11, в котором В является 3-пиридиным или 4-пиридиным кольцом, необязательно замещенным от одного до трех заместителями, независимо выбранными из R^6 ; J является $-CH_2CH_2-$ или $-CH_2CH_2CH_2-$; каждый R^5 независимо является CH_3 , Cl, Br, I, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, SCF_3 , $SCHF_2$, CO_2CH_3 или $CONHCH_3$ и каждый R^6 независимо является C_1-C_2 алкилом, C_1-C_2 галогеналкилом, галогеном, CN, C_1-C_2 алкокси, C_1-C_2 галогеналкокси, C_1-C_2 алкилтио, C_1-C_2 алкилсульфинилом или C_1-C_2 алкилсульфонилом и, по крайней мере, один R^6 расположен в положении орто к связи с W.

14. Способ по п.13, в котором В является 3-пиридиным кольцом, в котором один R^6 является Cl, расположенным в положении 2 орто к связи с $C=O$, другой R^6 выбирают из Cl или метила и он расположен в положении 4 орто к связи с $C=O$ и третий необязательный R^6 является метилом в положении 6.

15. Соединение по любому из пп.9–14, в котором R^1 является H и R^3 является H.

16. Соединение по п.9, которое является 2-хлор-6-метокси-N-(5,6,7,8-тетрагидро-3-метил-8-хинолинил)-4-пиридинкарбоксамидом.

17. Композиция, содержащая (а), по крайней мере, одно соединение формулы I по п.1 и (b), по крайней мере, одно соединение, выбранное из группы, включающей (b1) фунгициды на основе алкиленбис(дитиокарбамата); (b2) соединения, действующие на bc₁ комплекс митохондриального респираторного сайта переноса электронов гриба; (b3) цимоксанил; (b4) соединения, действующие на фермент деметилазу пути биосинтеза стерола; (b5) соединения морфолина и пиперидина, которые действуют на путь биосинтеза стерола; (b6) фунгициды на основе фениламида; (b7) фунгициды на основе пиримидинона; (b8) фталимиды и (b9) фозетил-алюминий.

18. Композиция по п.19, в которой компонент (b) включает, по крайней мере, одно соединение из двух различных групп, выбранных из (b1), (b2), (b3), (b4), (b5), (b6), (b7), (b8) и (b9).