



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(19) **RU** (11) **2 440 982** (13) **C2**

(51) МПК

<i>C07D 207/34</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/08</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/20</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/10</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/14</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/36</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/16</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/56</i>	(2006.01)
<i>C07D 401/12</i>	(2006.01)	<i>A01P 3/00</i>	(2006.01)
<i>C07D 403/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 405/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 409/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 307/56</i>	(2006.01)		
<i>C07D 333/38</i>	(2006.01)		

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2010107281/04, 31.07.2008

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
31.07.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
31.07.2007 EP 07356105.2
16.04.2008 EP 08356061.5

(43) Дата публикации заявки: 20.09.2011 Бюл. № 26

(45) Опубликовано: 27.01.2012 Бюл. № 3

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: WO 2006/120224 A1, 16.11.2006. WO 2007/087906 A1, 09.08.2007. WO 2008/065500 A2, 05.06.2008. WO 2007/117778 A2, 18.10.2007. RU 2003125855 A, 10.01.2005.

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 01.03.2010

(86) Заявка РСТ:
EP 2008/060040 (31.07.2008)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2009/016221 (05.02.2009)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

ДЕСБОРД Филипп (FR),
ГАРИ Стефани (FR),
ГРОСЖАН-КУРНУАЕ Мари-Клер (FR),
АРТМАНН Бенуа (FR),
РИНОЛЬФИ Филипп (FR),
ТЮК Арунарит (FR),
ВОР Жан-Пьер (FR)

(73) Патентообладатель(и):

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС АГ (DE)

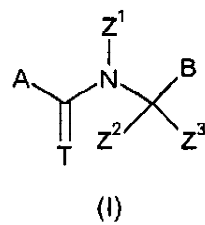
(54) ФУНГИЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ N-6-ЧЛЕННОГО КОНДЕНСИРОВАННОГО (ГЕТЕРО)АРИЛМЕТИЛЕН-N-ЦИКЛОАЛКИЛКАРБОКСАМИДА

(57) Реферат:

Изобретение относится к соединениям общей формулы (I), где А представляет собой присоединенную через атом углерода 5-членную гетероциклическую группу, выбранную из тиофенила, фуранила, пиразолила и пирролила, которая может быть замещена от одной до трех R^a - группами; Т представляет собой О, S; В является таким, как

показано в формуле изобретения; Z¹ представляет собой незамещенный циклопропил; Z² представляет собой атом водорода, C₁-C₈алкил или C₁-C₈алкоксикарбонил; Z³ независимо представляют собой атом водорода. Также изобретение относится к фунгицидной композиции, содержащей соединения формулы (I) в качестве активного ингредиента,

и способу борьбы с фитопатогенными грибами у сельскохозяйственных растений. Технический результат - соединения формулы (I), обладающие фунгицидной активностью. 3 н. и 6 з.п. ф-лы, 1 табл.



RU 2 4 4 0 9 8 2 C 2

RU 2 4 4 0 9 8 2 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(19) **RU** (11) **2 440 982** (13) **C2**

(51) Int. Cl.

<i>C07D 207/34</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/08</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/20</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/10</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/14</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/36</i>	(2006.01)
<i>C07D 231/16</i>	(2006.01)	<i>A01N 43/56</i>	(2006.01)
<i>C07D 401/12</i>	(2006.01)	<i>A01P 3/00</i>	(2006.01)
<i>C07D 403/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 405/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 409/12</i>	(2006.01)		
<i>C07D 307/56</i>	(2006.01)		
<i>C07D 333/38</i>	(2006.01)		

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21)(22) Application: 2010107281/04, 31.07.2008

(24) Effective date for property rights:
31.07.2008

Priority:

(30) Priority:
31.07.2007 EP 07356105.2
16.04.2008 EP 08356061.5

(43) Application published: 20.09.2011 Bull. 26

(45) Date of publication: 27.01.2012 Bull. 3

(85) Commencement of national phase: 01.03.2010

(86) PCT application:
EP 2008/060040 (31.07.2008)

(87) PCT publication:
WO 2009/016221 (05.02.2009)

Mail address:
129090, Moskva, ul.B.Spaskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoj

(72) Inventor(s):

DESBORD Filipp (FR),
GARI Stefani (FR),
GROSZhan-KURNUE Mari-Kler (FR),
ARTMANN Benua (FR),
RINOL'FI Filipp (FR),
TJuK Arunarit (FR),
VOR Zhan-P'er (FR)

(73) Proprietor(s):

BAJER KROPSAJENS AG (DE)

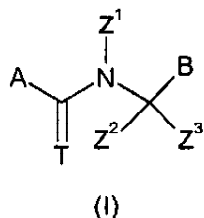
(54) FUNGICIDAL DERIVATIVES OF N-6-MEMBER CONDENSED (HETERO)ARYLMETHYLENE-N-CYCLOALKYLCARBOXAMIDE

(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to compounds of general formula

, where X denotes a 5-



member heterocyclic group bonded through a carbon atom, selected from thiophenyl, furanyl, pyrazolyl

and pyrrolyl, which can be substituted with 1-3 R^a groups; T denotes O, S; B is as indicated in the claim; Z¹ denotes an unsubstituted cyclopropyl; Z² denotes a hydrogen atom, C₁-C₈alkyl; or C₁-C₈alkoxycarbonyl; Z³ independently denotes a hydrogen atom. The invention also relates to a fungicidal composition containing a compound of formula (I) as an active ingredient, and a plant pathogenic fungus control method in agricultural plants.

EFFECT: obtaining compounds of formula (I), having fungicidal activity.

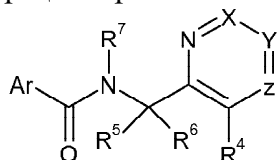
9 cl, 3 dwg, 255 ex

Настоящее изобретение относится к производным N-(ароматического 6-членного конденсированного (гетеро)арилметил)-N-циклоалкилкарбоксамида, их тиокарбоксамидным или N-замещенным карбоксимидамидным аналогам, способам их получения, применению их в качестве фунгицидных активных агентов, в частности в виде фунгицидных композиций, и способам борьбы с фитопатогенными грибами, особенно у растений, с применением таких соединений или композиций.

В международной патентной заявке WO-2001/11966, как правило, указаны определенные производные галогеналкил-2-пиридилметил-гетероцикламида.

Однако в данном документе не раскрыто ни одно из таких производных, замещенное любой циклоалкильной группой.

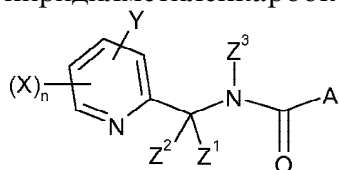
В международной патентной заявке WO-2004/074259 раскрыты рецепторсвязывающие соединения GABA, имеющие следующую формулу:



где Ar может представлять собой 5-10-членный гетероцикл, R^7 может представлять собой C_3 - C_7 циклоалкил, в то время как X, Y и Z могут представлять собой N или CR^1 , по меньшей мере один из них представляет собой N.

Однако в данном документе не раскрыто ни одно из соединений, включающих 5-членный гетероцикл или циклоалкил, связанный с атомом азота.

В международной патентной заявке WO-2006/120224 раскрыты производные 2-пиридилметилкарбоксамида, имеющие следующую формулу:

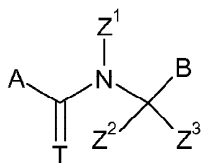


в котором нет какого-либо указания на получение фунгицидных бициклических производных согласно настоящему изобретению.

В международной патентной заявке WO-2007/117778 раскрыты производные хинолина, полезные в качестве индуцибельных ингибиторов синтазы оксида азота, включая N-циклопропил-N-((7,8-фтор-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-4-ил)метил)-4-метилтиазол-5-карбоксамид и N-циклопропил-N-((8-фтор-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-4-ил)метил)-4-метилтиазол-5-карбоксамид. Данные соединения не являются частью настоящего изобретения.

В сельском хозяйстве всегда проявляется высокий интерес к применению новых пестицидных соединений для того, чтобы избежать или бороться с развитием штаммов, стойких к активным ингредиентам. Также проявляется высокий интерес к применению новых соединений, являющихся более активными, чем уже известные, с целью уменьшения количества применяемого активного соединения, сохраняя при этом эффективность, по меньшей мере эквивалентную уже известным соединениям. В настоящее время авторы обнаружили новое семейство соединений, которые обладают вышеуказанными эффектами или преимуществами.

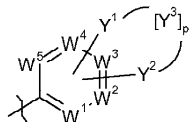
Соответственно, настоящее изобретение относится к производным N-(ароматического 6-членного конденсированного (гетеро)арилметил)-N-циклоалкилкарбоксамида, имеющим формулу (I)



(I)

где А представляет собой присоединенную через атом углерода, ненасыщенную или частично насыщенную 5-членную гетероциклическую группу, которая может быть

В представляет собой



где W¹-W⁵ независимо представляют собой N или CR^{b1};

Y¹-Y³ независимо представляют собой N, O, S, NR^{b2} или CR^{b3};

Y¹-Y³ вместе с атомами Wⁿ, к которым они присоединены, образуют ароматическое 5- или 6-членное конденсированное гетероциклическое кольцо, включающее до четырех гетероатомов, или ароматическое 6-членное конденсированное карбоциклическое кольцо;

р равен 1 или 2;

Т представляет собой O, S, N-R^c, N-OR^d, N-NR^cR^d или N-CN;

Z¹ представляет собой незамещенный C₃-C₇циклоалкил или C₃-C₇циклоалкил, замещенный вплоть до 10 атомами или группами, которые могут быть одинаковыми или различными, и которые могут быть выбраны из списка, состоящего из атомов галогена; циано; C₁-C₈алкила; C₁-C₈галогеналкила, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкокси; C₁-C₈галогеналкокси, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкоксикарбонила; C₁-C₈галогеналкоксикарбонила, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкиламинокарбонила; ди(C₁-C₈алкил)аминокарбонила;

Z² и Z³ независимо представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈алкенил; C₂-C₈алкинил; циано; нитро; C₁-C₈алкокси; C₂-C₈алкенилокси; C₂-C₈алкинилокси; C₃-C₇циклоалкил; C₁-C₈алкилсульфенил; амино; C₁-C₈алкиламино; ди(C₁-C₈алкил)амино; C₁-C₈алкоксикарбонил; C₁-C₈алкилкарбонил; C₁-C₈алкилкарбамоил; ди(C₁-C₈алкил)карбамоил; N-C₁-C₈алкил-C₁-C₈алкоксикарбамоил или

Z² и Z³ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, могут образовывать замещенный или незамещенный C₃-C₇циклоалкил;

R^a независимо представляет собой атом водорода; атом галогена; циано; нитро; амино; сульфанил; гидроксил; пентафтор-λ-6-сульфанил; C₁-C₈алкиламино; ди(C₁-C₈алкил)амино; три(C₁-C₈алкил)силил; три(C₁-C₈алкил)силил C₁-C₈алкил; C₁-C₈алкилсульфанил; C₁-C₈галогеналкилсульфанил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или

различными; C₂-C₈алкенил; C₂-C₈галогеналкенил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈алкинил; C₂-C₈галогеналкинил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкокси; C₁-C₈алкокси-C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈алкенилокси; C₂-C₈алкинилокси; C₃-C₇циклоалкил; C₃-C₇циклоалкил-C₁-C₈алкил; C₁-C₈алкилсульфинил; C₁-C₈алкилсульфонил; C₁-C₈алкоксиимино; (C₁-C₈алкоксиимино)-C₁-C₈алкил; (бензилоксиимино)-C₁-C₈алкил; C₁-C₈алкилкарбонил; C₁-C₈галогеналкилкарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкоксикарбонил; C₁-C₈галогеналкоксикарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈алкиламинокарбонил; ди(C₁-C₈алкил)аминокарбонил;

R^c и R^d , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил; C_2 - C_8 алкенил; C_2 - C_8 галогеналкенил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 алкинил; C_2 - C_8 галогеналкинил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_3 - C_7 циклоалкил; C_3 - C_7 циклоалкил- C_1 - C_8 алкил; C_3 - C_7 галогенциклоалкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; формил; C_1 - C_8 алкилкарбонил; C_1 - C_8 галогеналкилкарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкилсульфонил; C_1 - C_8 галогеналкилсульфонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; фенил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; нафтил, который может быть замещен вплоть до 6 группами Q; фенилметилен, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; фенилсульфонил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q;

R^{b1} и R^{b3} независимо представляют собой атом водорода; атом галогена; нитро; циано; гидроксил; сульфанил; amino; пентафтор- $\lambda 6$ -сульфанил; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкиламино; ди(C_1 - C_8 алкил)амино; C_1 - C_8 алкокси; C_1 - C_8 галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 алкилсульфанил; C_1 - C_8 галогеналкилсульфанил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкилсульфенил, C_1 - C_8 галогеналкилсульфенил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкилсульфинил, C_1 - C_8 галогеналкилсульфинил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкилсульфонил, C_1 - C_8 галогеналкилсульфонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 алкенил; C_2 - C_8 галогеналкенил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 алкинил; C_2 - C_8 галогеналкинил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 алкенилокси; C_2 - C_8 галогеналкенилокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 алкинилокси; C_2 -

С₈галогеналкинилокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₃-С₇циклоалкил; С₃-С₇циклоалкил-С₁-С₈алкил; С₃-С₇галогенциклоалкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; формил; формилокси; формиламино; карбокси; карбамоил; N-гидроксикарбамоил; карбамат; (гидроксиимино)-С₁-С₈алкил; С₁-С₈алкилкарбонил; С₁-С₈галогеналкилкарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; N-С₁-С₈алкил-С₁-С₈алкоксикарбамоил; С₁-С₈алкоксикарбонил; С₁-С₈галогеналкоксикарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₁-С₈алкиламинокарбонил; ди(С₁-С₈алкил)аминокарбонил; С₁-С₈алкилкарбонилокси; С₁-С₈галогеналкилкарбонилокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₁-С₈алкилкарбониламино; С₁-С₈алкиламинокарбонилокси; ди(С₁-С₈алкил)аминокарбонилокси; С₁-С₈алкилоксикарбонилокси; С₁-С₈алкоксиимино; (С₁-С₈алкоксиимино)-С₁-С₈алкил; (С₁-С₈алкенилоксиимино)-С₁-С₈алкил; (С₁-С₈алкинилоксиимино)-С₁-С₈алкил; (бензилоксиимино)-С₁-С₈алкил; три(С₁-С₈алкил)силил; три(С₁-С₈алкил)силил-С₁-С₈алкил; фенил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; бензилокси, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; бензилсульфанил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; бензиламин, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; фенокси, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; фениламин, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; фенилсульфанил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; бензил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q; пиридинил, который может быть замещен вплоть до четырьмя группами Q, и пиридинилокси, который может быть замещен вплоть до четырьмя группами Q;

R^{b2} представляет собой атом водорода; С₁-С₈алкил; С₁-С₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₁-С₈алкокси-С₁-С₈алкил; С₂-С₈алкенил; С₂-С₈галогеналкенил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₂-С₈алкинил; С₂-С₈галогеналкинил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₃-С₇циклоалкил; С₃-С₇циклоалкил-С₁-С₈алкил; С₃-С₁галогенциклоалкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; формил, С₁-С₈алкилкарбонил; С₁-С₈галогеналкилкарбонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₁-С₈алкилсульфонил; С₁-С₈галогеналкилсульфонил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; фенилсульфонил может быть замещен вплоть до 5 группами Q; бензил, который может быть замещен вплоть до 5 группами Q;

Q, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; циано; нитро; С₁-С₈алкил; С₁-С₈алкокси; С₁-С₈алкилсульфанил; С₁-С₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; С₁-С₈галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; три(С₁-С₈)алкилсилил и три(С₁-С₈)алкилсилил-С₁-С₈алкил; С₁-С₈алкоксиимино; (С₁-С₈алкоксиимино)-С₁-С₈алкил,

а также их солям, N-оксидам, металлическим комплексам, металлоидным

комплексам и их оптически активным или геометрическим изомерам, при условии, что соединение формулы (I) отличается от N-циклопропил-N-((6,8-диметил-2-оксо-1,2-дигидрохиолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклопропил-N-((6-этокси-2-оксо-1,2-дигидрохиолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклопропил-N-((6-метил-2-оксо-1,2-дигидрохиолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклопропил-N-((7,8-дифтор-2-оксо-1,2-дигидрохиолин-4-ил)метил)-4-метилтиазол-5-карбоксамида и N-циклопропил-N-((8-фтор-2-оксо-1,2-дигидрохиолин-4-ил)метил)-4-метилтиазол-5-карбоксамида.

Любое из соединений согласно настоящему изобретению может существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров в зависимости от количества стереогенных центров (по определению правилами IUPAC) в соединении. Настоящее изобретение, таким образом, одинаково относится ко всем стереоизомерам и смесям всех возможных стереоизомеров в любых пропорциях. Стереоизомеры можно разделить способами, известными *per se* специалисту в данной области.

Согласно настоящему изобретению следующие общие термины, как правило, используют со следующими значениями:

галоген означает фтор, хлор, бром или иод;

гетероатомом может быть азот, кислород или сера;

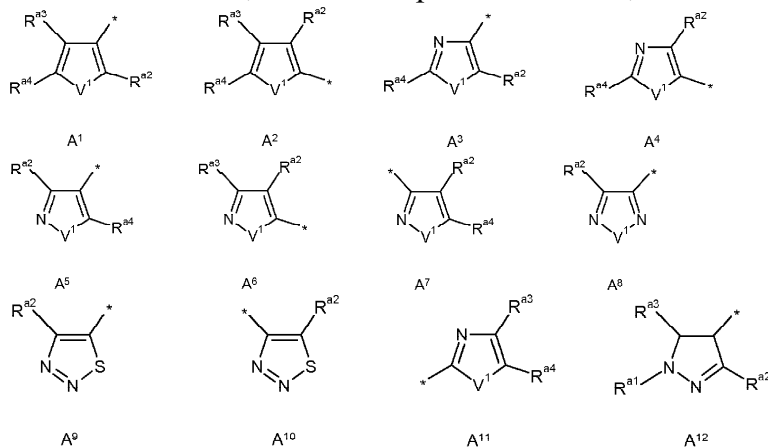
галогензамещенные группы, особенно галогеналкил, галогеналкокси и циклоалкильные группы, могут включать до девяти одинаковых или различных атомов галогена;

любая алкильная, алкенильная или алкинильная группа может быть линейной или разветвленной;

термин "арил" означает фенил или нафтил, необязательно замещенный одной-пятью группами, выбранными из списка, состоящего из галогена, [C₁-C₆]алкила, [C₁-C₆]галогеналкила, [C₂-C₆]алкенила, [C₂-C₆]галогеналкенила, [C₂-C₆]алкинила, [C₂-C₆]галогеналкинила, [C₁-C₆]алкокси, [C₁-C₄]алкокси-[C₁-C₄]алкила, [C₁-C₄]алкокси-[C₁-C₄]алкокси, [C₁-C₆]галогеналкокси и [C₁-C₄]галогеналкокси-[C₁-C₄]алкила.

В случае аминогруппы или аминофрагмента любой другой группы, включающей амино, замещенной двумя заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, такие два заместителя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, могут образовывать гетероциклическую группу, предпочтительно 5-7-членную гетероциклическую группу, которая может быть замещена или может включать другие гетероатомы, например морфолиногруппа или пиперидинил.

Предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где А выбирают из списка, состоящего из



где * представляет собой точку присоединения к карбонильному фрагменту;

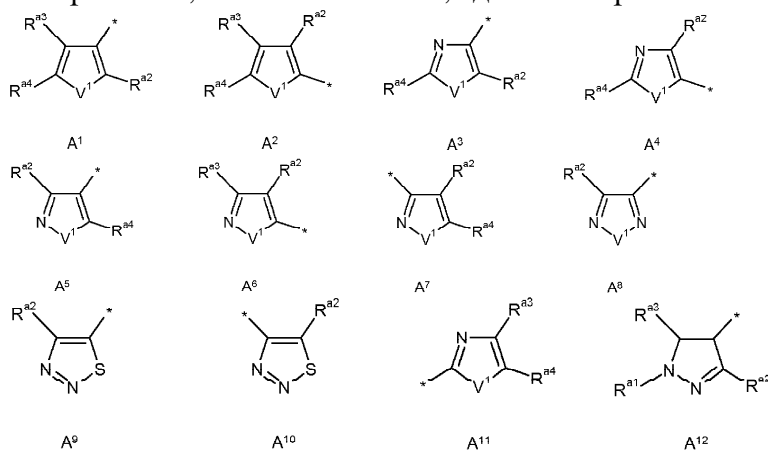
V^1 представляет собой O, S или NR^{a1} ;

R^{a1} представляет собой атом водорода; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил;

R^{a2} и R^{a3} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют атом водорода; атом галогена; циано; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси или C_1 - C_8 галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_3 - C_7 циклоалкил;

R^{a4} представляет собой атом водорода, атом галогена; циано; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси или C_1 - C_8 галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_3 - C_7 циклоалкил; C_1 - C_8 алкилсульфанил; амино; C_1 - C_8 алкиламино; ди(C_1 - C_8 алкил)амино; C_1 - C_8 алкилоксикарбонил.

Более предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где A выбирают из списка, состоящего из



где * представляет собой точку присоединения к карбонильной группе;

V^1 представляет собой O, S или NR^{a1} ;

R^{a1} представляет собой атом водорода; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил;

R^{a2} представляет собой C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси;

R^{a3} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил;

R^{a4} представляет собой атом водорода, атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

Другие более предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где

A представляет собой A⁵;

V^1 представляет собой NR^{a1} ;

R^{a1} представляет собой C_1 - C_8 алкил;

R^{a2} и R^{a3} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или

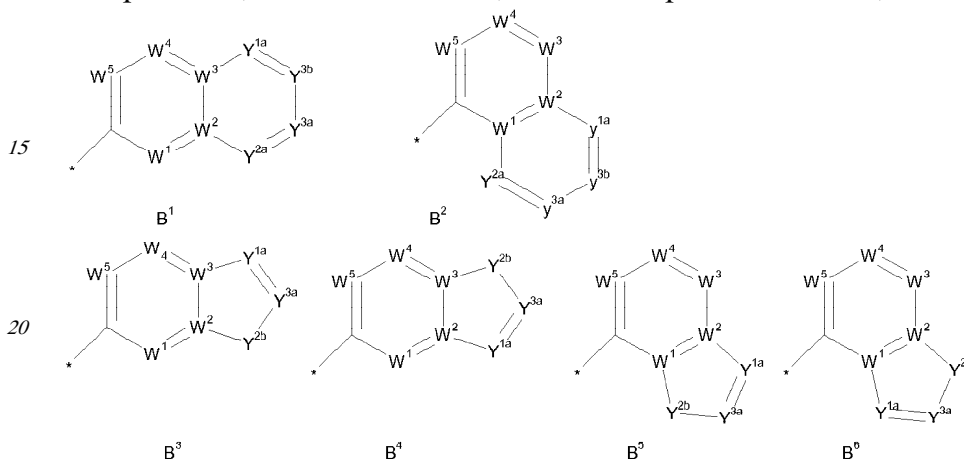
A представляет собой A^4 ;

V^1 представляет собой S;

R^{a2} представляет собой C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{a4} представляет собой атом водорода; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где B выбирают из списка, состоящего из



где W^1 - W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} и Y^{3b} независимо представляют собой NR^{b2} или CR^{b3} ; Y^{2b} представляет собой O, S или NR^{b2} .

Другие более предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где B представляет собой B^1 или B^2 ; W^1 - W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} и Y^{3b} независимо представляют собой CR^{b3} , или B представляет собой B^5 или B^6 ; W^1 - W^5 , Y^{1a} и Y^{3a} независимо представляют собой CR^{b1} ; Y^{2b} представляет собой S.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где T представляет собой O или S.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где Z^1 представляет собой циклопропил.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где Z^2 и Z^3 независимо представляют собой атом водорода или C_1 - C_8 алкил.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где Q представляет собой атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 алкокси; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

Приведенные выше предпочтения относительно заместителей соединений формулы (I) согласно настоящему изобретению можно комбинировать различными способами, как индивидуально, частично, так и целиком. Такие комбинации предпочтительных свойств, таким образом, обеспечивают подклассы соединений согласно настоящему изобретению. Примеры таких подклассов предпочтительных соединений согласно настоящему изобретению могут объединять:

предпочтительные значения A с предпочтительными значениями одного или более из T, Z^1 - Z^3 , R^a , R^b , T, V^1 и Q;

предпочтительные значения Т с предпочтительными значениями одного или более из A, Z¹-Z³, R^a, R^b, V¹ и Q;

предпочтительные значения Z¹ с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z², Z³, R^a, R^b, V¹ и Q;

предпочтительные значения Z² с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹, Z³, R^a, R^b, V¹ и Q;

предпочтительные значения Z³ с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹, Z², R^a, R^b, V¹ и Q;

предпочтительные значения R^a с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹-Z³, R^b, V¹ и Q;

предпочтительные значения R^b с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹-Z³, R^a, V¹ и Q;

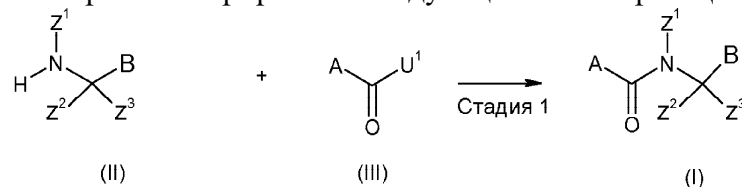
предпочтительные значения V¹ с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹-Z³, R^a, R^b и Q;

предпочтительные значения Q с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z¹-Z³, R^a, R^b и V¹;

В указанных комбинациях предпочтительных значений заместителей соединений согласно настоящему изобретению указанные предпочтительные значения могут также быть выбраны из более предпочтительных значений каждого из A, T, Z¹-Z³, R^a, R^b, V¹ и Q, таким образом, чтобы образовать наиболее предпочтительные подклассы соединений согласно настоящему изобретению.

Настоящее изобретение также относится к способу получения соединений формулы (I).

Таким образом, согласно дополнительному аспекту настоящего изобретения предложен способ P1 получения соединения формулы (I), где Т представляет собой О, как проиллюстрировано следующей схемой реакции:



Способ P1

где A, Z¹-Z³, W¹-W⁵ и В являются такими, как определено в настоящем описании; U¹ представляет собой атом галогена или уходящую группу.

В способе P1 согласно настоящему изобретению стадию 1 можно выполнить при необходимости в присутствии растворителя и при необходимости в присутствии связующей кислоты.

Производные N-циклоалкиламина, имеющие формулу (II), известны или могут быть получены известными способами, такими как восстановительное аминирование альдегида или кетона (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006, p 2014 синтез соединений 7 и 8) или восстановление иминов (Tetrahedron, 2005, p 11689), или нуклеофильное замещение галогена, мезилата или тозилата (Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887, получение промежуточного соединения для соединения 28).

Производные карбоновой кислоты, имеющие формулу (III), известны или могут быть получены известными способами (WO-93/11117; EP-545 099; Nucleosides & Nucleotides, 1987, p.737-759, Bioorg. Med. Chem., 2002, p.2105-2108).

Подходящие связующие кислоты для осуществления способа P1 согласно настоящему изобретению в каждом случае представляют собой все неорганические и органические основания, являющиеся общепринятыми для таких реакций.

Предпочтительно использовать щелочноземельные металлы, гидриды щелочных металлов, гидроксиды щелочных металлов или алкоксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидрид натрия, гидроксид кальция, гидроксид калия, трет-бутоксид калия или другой гидроксид аммония, карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат цезия, карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия, ацетаты щелочных или щелочноземельных металлов, такие как ацетат натрия, ацетат калия, ацетат кальция, и также третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, диизопропилэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинпиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN) или диазабициклоундец (DBU). Также возможно работать при отсутствии дополнительного конденсирующего агента или использовать избыток аминного компонента, чтобы он одновременно действовал в качестве связующей кислоты.

Подходящие растворители для осуществления способа P1 согласно настоящему изобретению в каждом случае представляют собой все общепринятые инертные органические растворители. Предпочтительно использовать необязательно галогензамещенные алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, четыреххлористый углерод, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как простой диэтиловый эфир, простой диизопропиловый эфир, простой метил-трет-бутиловый эфир, простой метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, н- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон или гексаметилфосфорный триамид; сложные эфиры, такие как метилацетат или этилацетат, сульфоксиды, такие как диметилсульфоксид, или сульфоны, такие как сульфолан.

При осуществлении способа P1 согласно настоящему изобретению температуры реакции можно независимо изменять в пределах относительно широкого диапазона. Как правило, способы согласно настоящему изобретению осуществляют при температурах от 0 до 160°C, предпочтительно 10 до 120°C. Способ регулирования температуры для способов согласно настоящему изобретению состоит в применении микроволновой технологии.

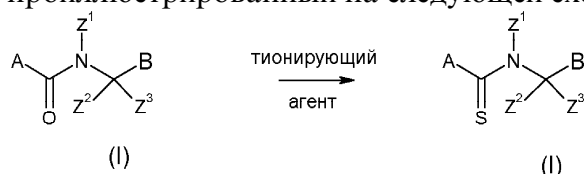
Способ P1 согласно настоящему изобретению, как правило, независимо осуществляют при атмосферном давлении. Однако в каждом случае также возможно работать при повышенном или пониженном давлении.

При проведении стадии 1 способа P1 согласно настоящему изобретению, как правило, 1 моль или другой избыток производного кислоты, имеющего формулу (III), и 1-3 моля связующей кислоты используют на 1 моль амина, имеющего формулу (II). Также можно использовать компоненты реакции в других соотношениях.

Выделение продукта реакции проводят общепринятыми способами. Как правило, реакционную смесь обрабатывают водой и органическую фазу отделяют и, после сушки, концентрируют при пониженном давлении. При необходимости остающийся остаток можно очищать от любых все еще присутствующих примесей общепринятыми

методами, такими как хроматография или перекристаллизация.

Согласно дополнительному аспекту настоящего изобретения приведен способ P2 получения соединения формулы (I), где Т представляет собой S, и проиллюстрированный на следующей схеме реакции:



10 **Способ P2** где A, Z¹-Z³, W¹-W⁵ и В являются такими, как определено в настоящем описании.

Способ P2 можно осуществлять в присутствии тионирующего агента.

Исходные производные амида, имеющие формулу (I), можно получить согласно способу P1.

Подходящие тионирующие агенты для осуществления способа P2 согласно настоящему изобретению могут являться серой (S), сероводородной кислотой (H₂S), сульфидом натрия (Na₂S), гидросульфидом натрия (NaHS), трисульфидом бора (B₂S₃), бис(диэтилалюминий)сульфидом ((AlEt₂)₂S), сульфидом аммония ((NH₄)₂S), фосфористым пентасульфидом (P₂S₅), реагентом Лоуссона (2,4-бис(4-метоксифенил)-1,2,3,4-дителиади фосфетан-2,4-дисульфид) или тионирующим агентом на полимерной подложке, таким как описано в *J.Chem.Soc.Perkin 1, (2001), 358*.

Способ P2 можно осуществлять в присутствии или в отсутствие каталитического или стехиометрического, или большего количества основания, такого как неорганическое и органическое основание. Предпочтительно использовать карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия; гетероциклические ароматические основания, такие как пиридин, пиколлин, лутидин, коллидин, а также третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диметиламинопиридин или N-метилпиперидин.

Подходящие растворители для осуществления способа P2 согласно настоящему изобретению могут быть общепринятыми инертными органическими растворителями. Предпочтительно использовать необязательно галогензамещенные алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как простой петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, четыреххлористый углерод, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как простой диэтиловый эфир, простой диизопропиловый эфир, простой метил-трет-бутиловый эфир, простой метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан или 1,2-диэтоксиэтан; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; серные растворители, такие как сульфолан или дисульфид углерода.

При осуществлении способа P2 согласно настоящему изобретению температуры реакции можно изменять в пределах относительно широкого диапазона. Как правило, данные способы осуществляют при температурах от 0 до 160°C, предпочтительно от 10 до 120°C. Способ регулирования температуры для способов согласно настоящему изобретению состоит в применении микроволновой технологии.

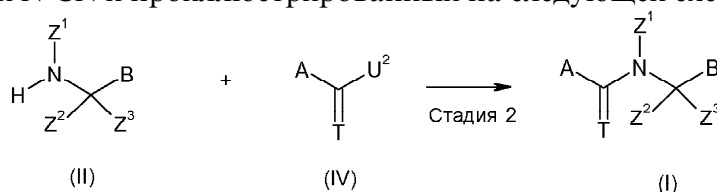
Способ P2 согласно настоящему изобретению, как правило, независимо осуществляют при атмосферном давлении. Однако в каждом случае, также возможно работать при повышенном или пониженном давлении.

При осуществлении способа Р2 согласно настоящему изобретению 1 моль или избыток серы, эквивалентный тионирующему агенту, и 1-3 моля основания можно использовать на 1 моль производного амида (I).

Также возможно использовать компоненты реакции в других соотношениях. Выделение продукта реакции проводят общепринятыми способами.

Как правило, реакционную смесь обрабатывают водой, органическую фазу отделяют и после сушки концентрируют при пониженном давлении. При необходимости остающийся остаток можно очистить от любых все еще присутствующих примесей общепринятыми методами, такими как хроматография или перекристаллизация.

Согласно дополнительному аспекту настоящего изобретения предложен способ Р3 получения соединения формулы (I), где Т представляет собой H-R^c, N-OR^d, N-NR^cR^d или N-CN и проиллюстрированный на следующей схеме реакции:



Способ Р3

где А, Z¹-Z³, W¹-W⁵ и В являются такими, как определено в настоящем описании; U² представляет собой атом хлора или метилсульфанильную группу,

В способе Р3 согласно настоящему изобретению стадию 2 можно проводить в присутствии связующей кислоты и в присутствии растворителя.

Производные N-циклоалкиламина, имеющие формулу (II), известны или могут быть получены известными способами, такими как восстановительное аминирование альдегида или кетона (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006, p 2014, синтез соединений 7 и 8) или восстановление иминов (Tetrahedron, 2005, p 11689), или нуклеофильное замещение галогена, мезилата или тозилата (Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887, получение промежуточного соединения для соединения 28).

N-Замещенный карбоксимидоилхлорид, имеющий формулу (IV), известен или может быть получен известными способами, например, как описано в Houben-Weyl, "Methoden der organischen Chemie" (1985), E5/1, p 628-633, и Patai, "The chemistry of amidines and imidates" (1975), p 296-301.

N-Замещенный или N,N-дизамещенный гидразоноилхлорид, имеющий формулу (IV), известны или могут быть получены известными способами, например, как описано в Tetrahedron, 1991, 47, p 447, и Journal of Heterocyclic Chemistry, 1983, 20, p 225.

N-Цианокарбоксимидоилхлорид, имеющий формулу (IV), известен или может быть получен известными способами, например, как описано в Tetrahedron Letters, 1968, p 5523, и Bioorganic And Medicinal Chemistry, 2006, p 4723.

Подходящие связующие кислоты для осуществления способа Р3 согласно настоящему изобретению могут быть неорганическими и органическими основаниями, общепринятыми для таких реакций. Предпочтительно использовать гидроксиды щелочноземельных или щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид кальция, гидроксид калия или другие производные гидроксида аммония; карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия; ацетаты щелочных или щелочноземельных металлов, такие как ацетат натрия, ацетат калия, ацетат кальция; гидриды щелочноземельных или щелочных металлов, такие как гидрид натрия или гидрид

калия; алкоголяты щелочноземельных или щелочных металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия, пропилат натрия или трет-бутилат калия, а также третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинопиридин,

5 диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN) или диазабициклоундецен (DBU); или акцепторы кислоты на полимерной подложке (например, как детально описано в <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

Также возможно работать при отсутствии любой дополнительной связующей

10 кислоты.

Подходящие растворители для осуществления способа РЗ согласно настоящему изобретению могут быть общепринятыми инертными органическими растворителями. Предпочтительно использовать необязательно галогензамещенные алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как простой петролейный

15 эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, четыреххлористый углерод, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как простой диэтиловый эфир, простой диизопропиловый эфир, простой метил-трет-бутиловый эфир, простой метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-

20 диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропониитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон или гексаметилфосфорный триамид; сложные эфиры, такие как сложный метилацетат или этилацетат, сульфоксиды, такие как диметилсульфоксид, или сульфоны, такие как сульфофан.

При осуществлении способа РЗ согласно настоящему изобретению температуры реакции можно менять в пределах относительно широкого диапазона. Как правило,

30 способы согласно настоящему изобретению осуществляют при температурах от 0 до 160°C, предпочтительно от 10 до 120°C. Способ регулирования температуры для способов согласно настоящему изобретению состоит в применении микроволновой технологии.

Способ РЗ согласно настоящему изобретению, как правило, независимо

35 осуществляют при атмосферном давлении. Однако в каждом случае также возможно работать при повышенном или пониженном давлении.

При осуществлении способа РЗ согласно настоящему изобретению производное амина, имеющее формулу (III), можно использовать в виде его соли, такой как

40 хлоргидрат или любая другая удобная соль.

При осуществлении способа РЗ согласно настоящему изобретению 1 моль или избыток производного амина, имеющего формулу (II), и 1-3 моля связующей кислоты можно использовать на 1 моль N-замещенного карбоксимидоилхлорида, имеющего формулу (IV).

45 Также можно использовать компоненты реакции в других соотношениях. Выделение продукта реакции проводят общепринятыми способами.

Как правило, реакционную смесь обрабатывают водой, органическую фазу отделяют и, после сушки, концентрируют при пониженном давлении. При

50 необходимости остающийся остаток можно очистить от любых все еще присутствующих примесей общепринятыми методами, такими как хроматография или перекристаллизация.

Соединения по настоящему изобретению можно получить вышеописанным

способом. Тем не менее следует понимать, что специалист в данной области на основе его общих знаний и доступных публикаций сможет приспособить данные способы в соответствии со специфическими особенностями каждого из соединений по настоящему изобретению, желательных для синтеза.

В дополнительном аспекте настоящее изобретение также относится к фунгицидной композиции, содержащей эффективное и нефитотоксичное количество активного соединения формулы (I).

Выражение "эффективное и нефитотоксичное количество" означает количество композиции по настоящему изобретению, достаточное для борьбы или уничтожения грибов, присутствующих или склонных к появлению в сельскохозяйственных культурах, и не влекущее за собой какого-либо заметного признака фитотоксичности для указанных сельскохозяйственных культур. Такое количество может изменяться в пределах широкого диапазона в зависимости от вида гриба, с которым необходимо бороться, типа сельскохозяйственной культуры, климатических условий и соединений, включенных в фунгицидную композицию по настоящему изобретению. Такое количество можно определить систематическими полевыми испытаниями, возможными для специалиста в данной области.

Таким образом, согласно настоящему изобретению предоставлена фунгицидная композиция, содержащая активный ингредиент, эффективное количество соединения, имеющего формулу (I), как определено в настоящем описании, и приемлемую с точки зрения сельского хозяйства подложку, носитель или наполнитель.

Согласно настоящему изобретению термин "подложка" означает природное или синтетическое, органическое или неорганическое соединение, с которым объединено или связано активное соединение формулы (I) для облегчения его применения, в частности, к частям растений. Данная подложка, таким образом, как правило, является инертной и должна быть приемлемой с точки зрения сельского хозяйства.

Подложка может быть твердой или жидкой. Примеры подходящих подложек включают глины, природные или синтетические силикаты, кварц, смолы, воски, твердые удобрения, воду, спирты, в частности бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла и их производные. Также можно использовать смеси таких подложек.

Композиция по настоящему изобретению может также содержать дополнительные компоненты. В частности, композиция может дополнительно включать поверхностно-активное вещество. Поверхностно-активное вещество может быть эмульгатором, диспергирующим агентом или смачивающим агентом ионогенного или

неионогенного типа или смесью таких поверхностно-активных веществ. Можно указать, например, соли полиакриловых кислот, соли лигносульфоновых кислот, соли фенолсульфоновых или нафталенсульфоновых кислот, поликонденсаты этиленоксида и жирных спиртов или жирных кислот или жирных аминов, замещенные фенолы (в частности алкилфенолы или арилфенолы), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (в частности, алкилтаураты), сложные эфиры фосфорной кислоты и полиоксиэтилированных спиртов или фенолов, сложные эфиры жирных кислот и полиолов, и производные вышеуказанных соединений, включающие сульфатные, сульфонатные и фосфатные функциональные группы. Присутствие по меньшей мере одного поверхностно-активного вещества, как правило, существенно, когда активное соединение и/или инертная подложка нерастворимы в воде и когда несущее средство для применения является водой. Предпочтительно содержание поверхностно-активного вещества может составлять от 5% до 40% по массе

композиции.

Также необязательно могут быть включены дополнительные компоненты, например защитные коллоиды, адгезивы, загустители, тиксотропные агенты, агенты, улучшающие текучесть, стабилизаторы, связующие агенты. В более общем смысле, активные соединения могут быть объединены с любой твердой или жидкой добавкой, которая соответствует обычным способам составления композиций.

Как правило, композиция по настоящему изобретению может содержать 0,05-99% по массе активного соединения, предпочтительно, 10-70% по массе.

Композиции по настоящему изобретению можно использовать в различных формах, таких как аэрозольный распылитель, суспензия капсул, холодный туманообразующий концентрат, распыляемый порошок, эмульгируемый концентрат, эмульсия масла в воде, эмульсия воды в масле, капсулированные гранулы, тонкие гранулы, сыпучий концентрат для обработки семян, газ (под давлением), газообразующий продукт, гранулы, горячий туманообразующий концентрат, макрогранулы, микрогранулы, диспергируемый в масле порошок, смешивающийся с маслом сыпучий концентрат, смешивающаяся с маслом жидкость, паста, растительные стержни, порошок для сухой обработки семян, семена, покрытые пестицидом, растворимый концентрат, растворимый порошок, раствор для обработки семян, концентрат суспензии (текущий концентрат), жидкость ультра малого объема (ULV), суспензия ультрамалого объема (ULV), диспергируемые в воде гранулы или таблетки, диспергируемый в воде порошок для шламовой обработки, растворимые в воде гранулы или таблетки, растворимый в воде порошок для обработки семян и смачиваемый порошок. Такие композиции включают не только композиции, готовые к применению к растениям или семенам, обрабатываемым посредством подходящего устройства, такого как устройство для разбрызгивания или распыления, но также и концентрированные коммерческие композиции, которые необходимо разбавлять перед применением к сельскохозяйственным культурам.

Соединения по настоящему изобретению можно также смешивать с одним или несколькими веществами с активным инсектицидным, фунгицидным, бактерицидным, аттрактантным, акарицидным или феромоновым действием или другими соединениями, обладающими биологическим действием. Смеси, полученные таким образом, обычно обладают, как правило, расширенным спектром действия. Смеси с другими фунгицидными соединениями особенно выгодны.

Примеры подходящих партнеров для смешивания с фунгицидом могут быть выбраны из следующего списка.

(1) Ингибиторы синтеза нуклеиновой кислоты, например беналаксил, беналаксил-М, бупиримат, клозилак, диметиримол, этиримол, фуралаксил, гимексазол, металаксил, металаксил-М, офурас, оксадиксил и оксолиновая кислота.

(2) Ингибиторы митоза и деления клетки, например беномил, карбендазим, хлорфеназол, диэтофенкарб, этабоксам, фуберидазол, пенцикурон, тиабендазол, тиофанат, тиофанат-метил и зоксамид.

(3) Ингибиторы дыхания, например дифлуметорим в качестве ингибитора CI-дыхания; биксафен, боскалид, карбоксин, фенфурам, флутоланил, флуопирам, фураметпир, фурмециклокс, изопиразам (9R-компонент), изопиразам (9S-компонент), мепронил, оксикарбоксин, пентиопирад, тифлузамид в качестве ингибитора CII-дыхания; амисулбром, азоксистробин, циазофамид, димоксистробин, энестроурин, фамоксадон, фенамидон, флуоксастробин, кресоксим-метил, метоминостробин, оризастробин, пикоксистробин, пиракlostробин, пирибенкарб, трифлуксистробин в

качестве ингибитора СШ-дыхания.

(4) Соединения, способные действовать в качестве разобщителя, как, например, бинапакрил, динокап, флузилам и мептилдинокап.

(5) Ингибиторы образования АТФ, например фентинацетат, фентинхлорид, гидроксид фентина и силтиофам.

(6) Ингибиторы биосинтеза аминокислот и/или белков, например андоприм, бластицидин-S, ципродинил, касугамицин, гидрат касугамицингидрохлорида, мепанипирим и пириметанил.

(7) Ингибиторы трансдукции сигнала, например фенпиклонил, флудиоксонил и квиноксифен.

(8) Ингибиторы синтеза липидов и мембран, например бифенил, хлостолинат, эдифенфос, этридиязол, иодокарб, ипробенфос, ипродион, изопропиолан, процимидон, пропамокарб, гидрохлорид пропамокарба, пиразофос, толклофос-метил и винклозолин.

(9) Ингибиторы биосинтеза эргостерола, например альдиморф, азакназол, битертанол, бромукназол, ципроконазол, диклобутразол, дифеноконазол, диниконазол, диниконазол-М, додеморф, ацетат додеморфа, эпоксиконазол, этаконазол, фенаримол, фенбуконазол, фенгексамид, фенпропидин, фенпропиморф, флуквинконазол, флурпримидол, флузилазол, флутриафол, фурконазол, цис-фурконазол, гексаконазол, имазалил, сульфат имазалила, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, нафтифин, нуаримол, окспоконазол, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пипералин, прохлораз, пропиконазол, протиоконазол, пирибутикарб, пирифенокс, квинконазол, симеконазол, спироksamин, тебуконазол, тербинафин, тетраконазол, триадимефон, триадименол, тридеморф, трифлумизол, трифорин, тритиконазол, униконазол, виниконазол и вориконазол.

(10) Ингибиторы синтеза клеточной стенки, например бентиаваликарб, диметоморф, флуморф, ипроваликарб, мандипропамид, полиоксины, полиоксорим, протиокарб, валидамицин А и валифенал.

(11) Ингибиторы биосинтеза меланина, например карпропамид, диклоцимет, феноксанил, фталид, пироквилон и трициклазол.

(12) Соединения, способные вызывать защитную реакцию растения-хозяина, как, например, ацибензолар-S-метил, пробеназол и тиадинил.

(13) Соединения, обладающие действием во многих местах, как, например, бордосская жидкость, каптафол, каптан, хлороталонил, нафтенат меди, оксид меди, оксихлорид меди, соединения меди, такие как гидроксид меди, сульфат меди, дихлофлуанид, дитианон, додин, додиновое свободное основание, фербам, фторфолпет, фолпет, гуазатин, ацетат гуазатина, иминоктадин, альбесилат иминоктадина, триацетат иминоктадина, манкоппер, манкозеп, манеб, метирам, цинк метирам, оксин-медь, пропамидин, пропиенеб, сера и соединения серы, включая полисульфид кальция, тирам, толифлуанид, цинеб и цирам.

(14) Дополнительные соединения, такие как, например, 2,3-дибутил-6-хлортиено[2,3-d]пиримидин-4(3H)-он, этил (2Z)-3-амин-2-циано-3-фенилпроп-2-эноат, N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1, 3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-{2-[1,1'-би(циклопропил)-2-ил]фенил}-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2E)-2-(2-{[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпиримидин-4-ил]окси}фенил)-2-

(метоксиимино)-N-метилэтанами́д,
 (2E)-2-{2-[(2E,3E)-4-(2,6-дихлорфенил)бут-3-ен-2-илиден]амин}окси)метил]фенил}-
 2-(метоксиимино)-N-метилэтанами́д,
 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)пиридин-3-карбокса́мид,
 N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-(формиламин)-2-гидроксибенза́мид,
 5-метокси-2-метил-4-(2-{[(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]амин}окси)
 метил]фенил)-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-он,
 (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-(2-{[(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]
 амин}окси)метил]фенил)этанами́д,
 (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-{2-[(E)-({1-[3-(трифторметил)фенил]этокси}
 ими́но)метил]фенил}этанами́д,
 (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-фтор-2-фенилэтенил]окси}фенил)этилиден]амин}
 окси)метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилэтанами́д,
 1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклогепта́нол,
 метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигидро-1H-инден-1-ил)-1H-имидазол-5-карбокси́лат,
 N-этил-N-метил-N'-{2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-(триметилсилил)пропокси]
 фенил}ими́доформа́мид,
 N'-{5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсилил)пропокси]фенил}-N-этил-N-
 метили́ми́доформа́мид,
 O-{1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропил}1H-имидазол-1-карбо́тиоат,
 N-[2-(4-{[3-(4-хлорфенил)проп-2-ин-1-ил]окси}-3-метоксифенил)этил]-N2-
 (метилсульфонил)вали́нами́д,
 5-хлор-7-(4-метилпиперидин-1-ил)-6-(2,4,6-трифторфенил)[1,2,4]триазоло[1,5-a]
 пирими́дин,
 5-амин-1,3,4-тиадиа́зол-2-тио́л, пропамокарб-фосети́л,
 1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропил-1H-имидазол-1-карбо́кси́лат,
 1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]-3-(трифторметил)-1H-пира́зол-4-
 карбо́кса́мид,
 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пири́дин,
 2-бутокси-6-иод-3-пропил-4H-хроме́н-4-он, 2-фенилфено́л и соли,
 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]-1H-пира́зол-4-
 карбо́кса́мид,
 3,4,5-трихлорпири́дин-2,6-дикарбо́нитри́л,
 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметилизоксазоли́дин-3-ил]пири́дин,
 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-6-метилпирида́зин,
 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторфенил)-3,6-диметилпирида́зин,
 хино́лин-8-ол, хино́лин-8-ола су́льфат (2:1) (со́ль), бен́тиазол,
 бетокса́зин, капсими́цин, карво́н, хинометио́нат, хлороне́б,
 куфра́неб, цифлуфена́мид, цимокса́нил, ципросу́льфами́д, дазо́мет,
 деба́карб, дихлоро́фен, дикломе́зин, диклора́н, дифензо́кват,
 метилсу́льфат дифензо́квата, дифенила́мин, э́комат, феримзо́н, флу́метове́р,
 флуо́пиколи́д, фторими́д, флу́сульфа́мид, фосети́л-алюми́ний, фосети́л-ка́льций,
 фосети́л-на́трий, гексахлорбензо́л,
 ирума́мицин, изоти́ани́л, метасу́льфокарб,
 метил (2E)-2-{2-[(циклопро́пил[(4-метоксифенил)ими́но]метил]тио)метил]фенил}-3-
 метоксиакри́лат,
 метили́зотиоциа́нат, метрафе́нон,
 (5-бром-2-метокси-4-метилпири́дин-3-ил)(2,3,4-триметокси-6-метилфенил)метано́н,

милдиомицин, толнифанид,

N-(4-хлорбензил)-3-[3-метокси-4-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]пропанамид,

N-[(4-хлорфенил)(циано)метил]-3-[3-метокси-4-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]

пропанамид,

N-[(5-бром-3-хлорпиридин-2-ил)метил]-2,4-дихлорпиридин-3-карбоксамид,

N-[1-(5-бром-3-хлорпиридин-2-ил)этил]-2,4-дихлорпиридин-3-карбоксамид,

N-[1-(5-бром-3-хлорпиридин-2-ил)этил]-2-фтор-4-иодопиридин-3-карбоксамид,

N-{(Z)-[(циклопропилметокси)имино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил}-2-

фенилацетамид,

N-{(E)-[(циклопропилметокси)имино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил}-2-

фенилацетамид,

натамицин, диметилдитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил,

октилинон, оксамокарб, оксифентиин, пентахлорфенол и соли,

феназин-1-карбоновая кислота, фенотрин, фосфористая кислота и ее соли,

пропамокарба фосэтилат, пропанозин-натрий, проквиназид, пирролнитрин,

квинтозен, S-проп-2-ен-1-ил 5-амин-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-3-оксо-2,3-

дигидро-1H-пиразол-1-карботиоат, теклофталам, текназин, триазоксид, трихламид, 5-

хлор-N'-фенил-N'-проп-2-ин-1-илтиофен-2-сульфоногидразид и зариламид.

Композиция по настоящему изобретению, содержащая смесь соединения формулы (I) с бактерицидным соединением также может быть особенно выгодной.

Примеры подходящих бактерицидных партнеров для смешивания можно выбрать из следующего списка: бронопол, дихлорофен, нитрапирин, диметилдитиокарбамат

никеля, касугамицин, октилинон, фуранкарбоновая кислота, окситетрациклин,

пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сульфат меди и другие соединения меди.

Соединения формулы (I) и фунгицидную композицию по настоящему изобретению можно использовать для лечебной или профилактической борьбы с фитопатогенными грибами у растений или сельскохозяйственных культур.

Таким образом, согласно дополнительному аспекту изобретения предложен способ лечебной или профилактической борьбы с фитопатогенными грибами у растений или сельскохозяйственных культур, характеризующийся тем, что соединение формулы (I) или фунгицидную композицию по настоящему изобретению применяют к семенам, растениям или плодам растений или к почве, в которой растут растения или в которой желательно их выращивание.

Способ обработки по настоящему изобретению может также быть полезным для обработки материалов для размножения, таких как клубни или ризомы, а также семена, сеянцы или проростки и растения или проростки растений. Данный способ обработки также может быть полезным для обработки корней. Способ обработки по настоящему изобретению также может быть полезным для обработки открытых частей растений, таких как стволы, стебли или ножки, листья, цветы и плоды рассматриваемого растения.

Среди растений, которые можно защитить способом по настоящему изобретению, можно указать хлопок; лен; виноградную лозу; фруктовые или овощные сельскохозяйственные культуры, такие как Rosaceae sp. (например, односемянные плоды, такие как яблоки и груши, а также косточковые плоды, такие как абрикосы, миндаль и персики), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (например, банановые деревья и plantains), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфрут); Solanaceae sp. (например,

томаты), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (например, салаты), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp., Papilionaceae sp. (например, горох), Rosaceae sp. (например, земляника); основные сельскохозяйственные культуры, такие как Graminae sp. (например, кукуруза, газонные или хлебные злаки, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень и тритикале), Asteraceae sp. (например, подсолнечник), Cruciferae sp. (например, рапс), Fabaceae sp. (например, арахис), Papilionaceae sp. (например, соя), Solanaceae sp. (например, картофель), Chenopodiaceae sp. (например, свекла), Elaeis sp. (например, масличная пальма); садовые и лесные сельскохозяйственные культуры, а также генетически модифицированные гомологи этих сельскохозяйственных культур.

Среди заболеваний растений или сельскохозяйственных культур, с которыми можно бороться способом по настоящему изобретению, можно указать следующие:

заболевания настоящей мучнистой росы, такие как
 заболевания *Blumeria*, вызываемые, например, *Blumeria graminis*;
 заболевания *Podosphaera*, вызываемые, например, *Podosphaera leucotricha*;
 заболевания *Sphaerotheca*, вызываемые, например, *Sphaerotheca fuliginea*;
 заболевания *Uncinula*, вызываемые, например, *Uncinula necator*;
 заболевания ржавчиной, такие как
 заболевания *Gymnosporangium*, вызываемые, например, *Gymnosporangium sabinae*;
 заболевания *Hemileia*, вызываемые, например, *Hemileia vastatrix*;
 заболевания *Phakopsora*, вызываемые, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomia*;
 заболевания *Puccinia*, вызываемые, например, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* или *Puccinia striiformis*;
 заболевания *Uromyces*, вызываемые, например, *Uromyces appendiculatus*;
 заболевания оомицетами, такие как
 заболевания *Albugo*, вызываемые, например, *Albugo candida*;
 заболевания *Bremia*, вызываемые, например, *Bremia lactucae*;
 заболевания *Peronospora*, вызываемые, например, *Peronospora pisi* и *Peronospora brassicae*;
 заболевания *Phytophthora*, вызываемые, например, *Phytophthora infestans*;
 заболевания *Plasmopara*, вызываемые, например, *Plasmopara viticola*;
 заболевания *Pseudoperonospora*, вызываемые, например, *Pseudoperonospora humuli* и *Pseudoperonospora cubensis*;
 заболевания *Pythium*, вызываемые, например, *Pythium ultimum*;
 заболевания листовой пятнистостью, септориозом листьев и повреждением листьев, такие как
 заболевания *Alternaria*, вызываемые, например, *Alternaria solani*;
 заболевания *Cercospora*, вызываемые, например, *Cercospora beticola*;
 заболевания *Cladosporium*, вызываемые, например, *Cladosporium cucumerinum*;
 заболевания *Cochliobolus*, вызываемые, например, *Cochliobolus sativus* (Conidiaform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*) или *Cochliobolus miyabeanus*;
 заболевания *Colletotrichum*, вызываемые, например, *Colletotrichum lindemuthianum*;
 заболевания *Cycloconium*, вызываемые, например, *Cycloconium oleaginum*;
 заболевания *Diaporthe*, вызываемые, например, *Diaporthe citri*;
 заболевания *Elsinoe*, вызываемые, например, *Elsinoe fawcettii*;
 заболевания *Gloeosporium*, вызываемые, например, *Gloeosporium laeticolor*;
 заболевания *Glomerella*, вызываемые, например, *Glomerella cingulata*;
 заболевания *Guignardia*, вызываемые, например, *Guignardia bidwellii*;

заболевания *Leptosphaeria*, вызываемые, например, *Leptosphaeria maculans* и *Leptosphaeria nodorum*;

заболевания *Magnaporthe*, вызываемые, например, *Magnaporthe grisea*;

заболевания *Mycosphaerella*, вызываемые, например, *Mycosphaerella graminicola*,
5 *Mycosphaerella arachidicola* и *Mycosphaerella fijiensis*;

заболевания *Phaeosphaeria*, вызываемые, например, *Phaeosphaeria nodorum*;

заболевания *Pyrenophora*, вызываемые, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora tritici repentis*;

10 заболеваний *Ramularia*, вызываемые, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*;

заболевания *Rhynchosporium*, вызываемые, например, *Rhynchosporium secalis*;

заболевания *Septoria*, вызываемые, например, *Septoria apii* и *Septoria lycopersici*;

заболевания *Typhula*, вызываемые, например, *Typhula incarnata*;

15 заболеваний *Venturia*, вызываемые, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корней, ложных стеблей, стеблей, такие как

заболевания *Corticium*, вызываемые, например, *Corticium graminearum*;

заболевания *Fusarium*, вызываемые, например, *Fusarium oxysporum*;

20 заболеваний *Gaeumannomyces*, вызываемые, например, *Gaeumannomyces graminis*;

заболевания *Rhizoctonia*, вызываемые, например, *Rhizoctonia solani*;

заболевания *Sarocladium*, вызываемые, например, *Sarocladium oryzae*;

заболевания *Sclerotium*, вызываемые, например, *Sclerotium oryzae*;

заболевания *Tapesia*, вызываемые, например, *Tapesia acuformis*;

25 заболеваний *Thielaviopsis*, вызываемые, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания початков и метелки, включая кочерыжку кукурузного початка, такие как

заболевания *Alternaria*, вызываемые, например, *Alternaria* spp.;

30 заболеваний *Aspergillus*, вызываемые, например, *Aspergillus flavus*;

заболевания *Cladosporium*, вызываемые, например, *Cladosporium cladosporioides*;

заболевания *Claviceps*, вызываемые, например, *Claviceps purpurea*;

заболевания *Fusarium*, вызываемые, например, *Fusarium culmorum*;

заболевания *Gibberella*, вызываемые, например, *Gibberella zeae*;

35 заболеваний *Monographella*, вызываемые, например, *Monographella nivalis*;

заболевания головней, такие как

заболевания *Sphacelotheca*, вызываемые, например, *Sphacelotheca reiliana*;

заболевания *Tilletia*, вызываемые, например, кариес *Tilletia*;

40 заболеваний *Urocystis*, вызываемые, например, *Urocystis occulta*;

заболевания *Ustilago*, вызываемые, например, *Ustilago nuda*;

заболевания фруктовой гнилью, плесенью, такие как

заболевания *Aspergillus*, вызываемые, например, *Aspergillus flavus*;

заболевания *Botrytis*, вызываемые, например, *Botrytis cinerea*;

45 заболеваний *Penicillium*, вызываемое, например, *Penicillium expansum* и *Penicillium purpurogenum*;

заболевания *Rhizopus*, вызываемое, например, *Rhizopus stolonifer*;

заболевания *Sclerotinia*, вызываемые, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;

50 заболеваний *Verticillium*, вызываемые, например, *Verticillium albo-atrum*;

заболевания гнилью, передающейся через почву и семена, плесенью, увяданием, гниением и полеганием, такие как

заболевания *Alternaria*, вызываемые, например, *Alternaria brassicicola*;

- заболевания *Aphanomyces*, вызываемые, например, *Aphanomyces euteiches*;
заболевания *Ascochyta*, вызываемые, например, *Ascochyta lentis*;
заболевания *Aspergillus*, вызываемые, например, *Aspergillus flavus*;
заболевания *Cladosporium*, вызываемые, например, *Cladosporium herbarum*;
5 заболевания *Cochliobolus*, вызываемые, например, *Cochliobolus sativus*;
(Conidiaform: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*);
заболевания *Colletotrichum*, вызываемые, например, *Colletotrichum coccodes*;
заболевания *Fusarium*, вызываемые, например, *Fusarium culmorum*;
10 заболевания *Gibberella*, вызываемые, например, *Gibberella zeae*;
заболевания *Macrophomina*, вызываемые, например, *Macrophomina phaseolina*;
заболевания *Microdochium*, вызываемые, например, *Microdochium nivale*;
заболевания *Monographella*, вызываемые, например, *Monographella nivalis*;
заболевания *Penicillium*, вызываемые, например, посредством *Penicillium expansum*;
15 заболевания *Phoma*, вызываемые, например, *Phoma lingam*;
заболевания *Phomopsis*, вызываемые, например, *Phomopsis sojae*;
заболевания *Phytophthora*, вызываемые, например, *Phytophthora cactorum*;
заболевания *Pyrenophora*, вызываемые, например, *Pyrenophora graminea*;
20 заболевания *Pyricularia*, вызываемые, например, *Pyricularia oryzae*;
заболевания *Pythium*, вызываемые, например, *Pythium ultimum*;
заболевания *Rhizoctonia*, вызываемые, например, *Rhizoctonia solani*;
заболевания *Rhizopus*, вызываемые, например, *Rhizopus oryzae*;
заболевания *Sclerotium*, вызываемые, например, *Sclerotium rolfsii*;
25 заболевания *Septoria*, вызываемые, например, *Septoria nodorum*;
заболевания *Typhula*, вызываемые, например, *Typhula incarnata*;
заболевания *Verticillium*, вызываемые, например, *Verticillium dahliae*;
заболевания раком, метелкой и отмиранием, такие как
30 заболевания *Nectria*, вызываемые, например, *Nectria galligena*;
заболевания увяданием, такие как
заболевания *Monilinia*, вызываемые, например, *Monilinia laxa*;
заболевания пузырчатостью листьев или курчавостью листьев, включая
деформацию цветков и плодов, такие как
35 заболевания *Exobasidium*, вызываемые *Exobasidium vexans*;
заболевания *Taphrina*, вызываемые, например, *Taphrina deformans*;
заболевания упадком или одревеснением растений, такие как
заболевание *Esca*, вызываемое, например, *Phaeomoniella clamydospora*,
40 *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*;
заболевания *Ganoderma*, вызываемые *Ganoderma boninense*;
заболевания цветов и семян, такие как
заболевания *Botrytis*, вызываемые, например, *Botrytis cinerea*;
заболевания клубней, такие как
45 заболевания *Rhizoctonia*, вызываемые, например, *Rhizoctonia solani*;
заболевания *Helminthosporium*, вызываемые, например, *Helminthosporium solani*;
заболевания килой, такие как
заболевания *Plasmodiophora*, вызываемые, например, *Plasmodiophora brassicae*.
50 Заболевания, вызываемые бактериальными организмами, такие как
виды *Xanthomonas*, например *Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*;
виды *Pseudomonas*, например *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
виды *Erwinia*, например *Erwinia amylovora*.

Фунгицидную композицию по настоящему изобретению также можно использовать против грибковых заболеваний, склонных расти на или в лесоматериале. Термин "лесоматериал" означает все типы видов древесины и все типы обработки этой древесины, предназначенные для строительства, например, твердая древесина, высокоплотная древесина, ламинированная древесина и фанера. Способ обработки лесоматериала по настоящему изобретению, главным образом, состоит в контактировании с одним или несколькими соединениями по настоящему изобретению или композицией по настоящему изобретению, включающем, например, прямое нанесение, разбрызгивание, окунание, инъекцию или любые другие подходящие средства.

Доза активного соединения, применяемая обычно в способе обработки по настоящему изобретению, как правило и преимущественно, составляет от 10 до 800 г/га, предпочтительно от 50 до 300 г/га для применений в лиственной обработке. Доза активного вещества, применяемого, как правило и преимущественно, составляет от 2 до 200 г на 100 кг семян, предпочтительно от 3 до 150 г на 100 кг семян в случае обработки семян.

Подразумевается, что дозы, указанные в настоящем описании, приведены в качестве иллюстративных примеров способа по настоящему изобретению. Специалисту в данной области известно, как приспособить дозы применения, в частности, согласно природе обрабатываемого растения или сельскохозяйственной культуры.

Фунгицидную композицию по настоящему изобретению также можно использовать в обработке генетически модифицированных организмов соединениями по настоящему изобретению или агрохимическими композициям по настоящему изобретению. Генетически модифицированные растения являются растениями, в геном которых устойчиво введен гетерологический ген, кодирующий представляющий интерес белок. Выражение "гетерологический ген, кодирующий представляющий интерес белок" по существу, означает гены, придающие трансформированному растению новые агрономические свойства, или гены для улучшения агрономического качества модифицированного растения.

Соединения или смеси по настоящему изобретению также можно использовать для получения композиции, полезной для лечения или профилактики грибковых заболеваний человека или животного, таких как, например, микозы, дерматозы, заболевания трихофитомом и кандидозы или заболевания, вызываемые *Aspergillus spp.*, например, *Aspergillus fumigatus*.

Различные аспекты настоящего изобретения будут проиллюстрированы в следующей таблице примеров соединения и следующих примеров получения.

Следующая таблица неограничивающим образом иллюстрирует примеры соединений по настоящему изобретению.

В следующей таблице М+Н (или М-Н) означает пик молекулярных ионов плюс или минус 1 а.е.м. (атомная единица массы) соответственно, как наблюдается в массовой спектроскопии, и М (Arcl+) означает пик молекулярных ионов, как он обнаруживается через положительную химическую ионизацию при атмосферном давлении в массовой спектроскопии.

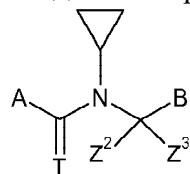
В следующей таблице значения logP определены в соответствии с EEC Directive 79/831 Annex V.A8 колоночной ВЭЖХ (высокоэффективная жидкостная хроматография) с обращенной фазой (C18), с применением описанного ниже способа: температура 40°C; подвижные фазы: 0,1% водная муравьиная кислота и

ацетонитрил; линейный градиент от 10% ацетонитрила до 90% ацетонитрила.

Калибровку выполняли с использованием алкан-2-онов (включающих 3-16 атомов углерода) с известными значениями logP (определение значений logP по времени удерживания с линейной интерполяцией между двумя последовательными алканами).

Максимальные значения лямбды определяли по максимумам хроматографических сигналов с применением УФ-спектров от 190 до 400 нм.

Следующие примеры иллюстрируют неограничивающим образом получение соединений формулы (I) по настоящему изобретению.



Пр. №	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
1	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
2	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
3	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			354
4	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
5	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356
6	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			370
7	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
8	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			350
9	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
10	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			368
11	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			370
12	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			384
13	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			333
14	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			348

5

10

15

20

25

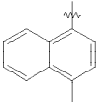
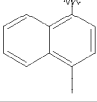
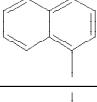
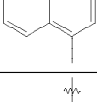
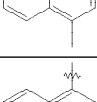
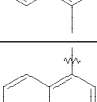
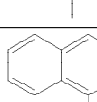
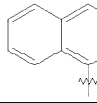
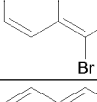
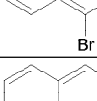
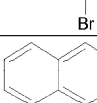
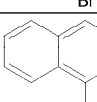
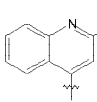
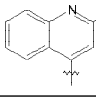


30

35

40

45

50

15	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			350
16	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			366
17	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
18	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	Me	H			420
19	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			334
20	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			364
21	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			401
22	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
23	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
24	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
25	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H		4,39	
26	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,68	
27	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		3,24	
28	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H		4,25	
29	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
30	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			421

5

10

15

20

25

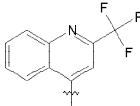
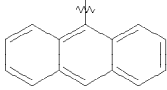
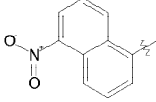
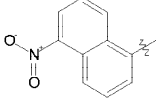
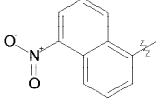
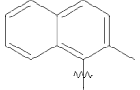
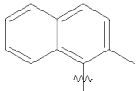
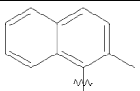
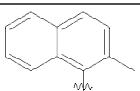
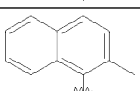
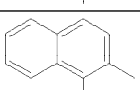
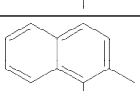
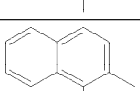
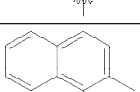
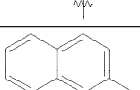
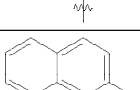
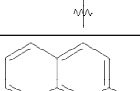
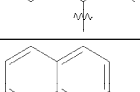
30

35

40

45

50

31	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425
32	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			406
33	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			383
34	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			401
35	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			381
36	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
37	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
38	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
39	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
40	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,25	
41	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
42	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H			366
43	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			
44	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			319
45	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			334
46	A2	S	Me	H	H	O	H	H			336
47	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			406
48	A1	O	Me	H	H	O	H	H			320

5

10

15

20

25

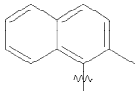
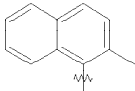
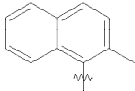
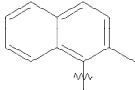
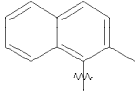
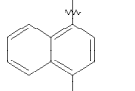
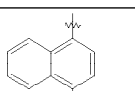
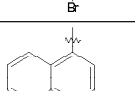
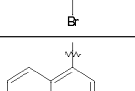
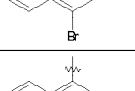
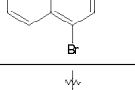
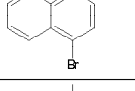
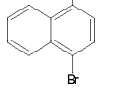
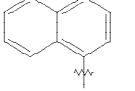
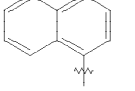
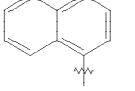
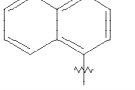
30

35

40

45

50

49	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			387
50	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
51	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
52	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	S	H	H			373
53	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
54	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		3,62	
55	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,69	
56	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
57	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			430
58	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			444
59	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			448
60	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		5,2	
61	A5	N-Me	CF ₃	-	H	O	COOMe	H			432
62	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	COOMe	H			431
63	A5	N-Me	Me	-	F	O	COOMe	H		2,92	
64	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
65	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352

5

10

15

20

25

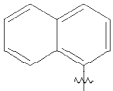
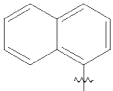
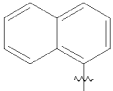
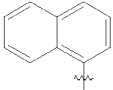
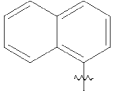
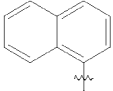
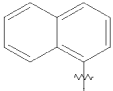
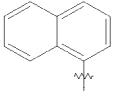
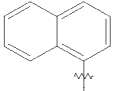
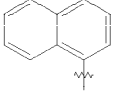
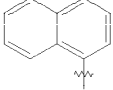
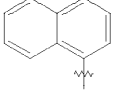
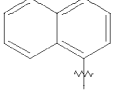
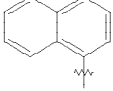
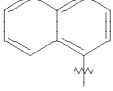
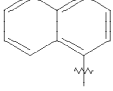
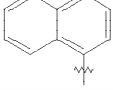
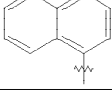
30

35

40

45

50

66	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
67	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			366
68	A5	N-Me	Et	-	F	S	Me	H			382
69	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	COOMe	H		3,02	
70	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356
71	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			370
72	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	S	H	H			372
73	A5	N-Me	OMe	-	H	O	COOMe	H			394
74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
75	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,86	
76	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			319
77	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			334
78	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			336
79	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	Me	H			406
80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
81	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
82	A1	N-Me	H	CHF ₂	H	O	Me	H			369
83	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H			366

5

10

15

20

25

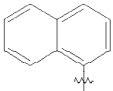
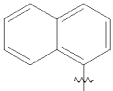
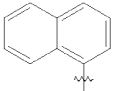
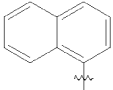
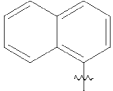
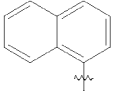
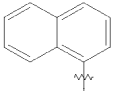
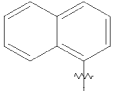
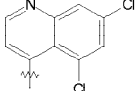
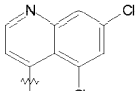
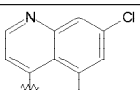
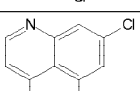
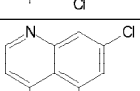
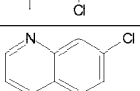
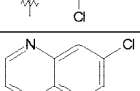
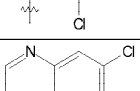
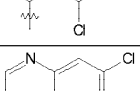
30

35

40

45

50

84	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			320
85	A5	N-Me	Et	-	F	O	Et	H			380
86	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Et	H			384
87	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
88	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
89	A5	N-Me	CHF ₂	-	F	O	Me	H			388
90	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			387
91	A5	N-Me	CF ₂ Me	-	H	O	Me	H			384
92	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			405
93	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			374
94	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			389
95	A2	S	Me	H	H	O	H	H			391
96	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			461
97	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
98	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425
99	A1	O	Me	H	H	O	H	H			375
100	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			442

5

10

15

20

25

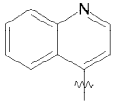
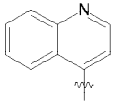
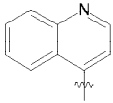
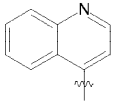
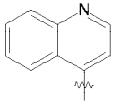
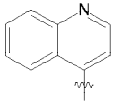
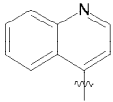
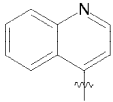
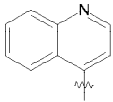
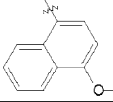
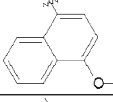
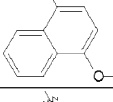
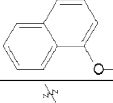
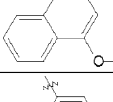
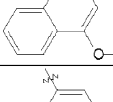
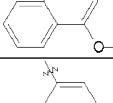
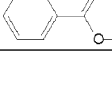
30

35

40

45

50

101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
102	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
103	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
104	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
105	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
107	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
108	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
109	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
110	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
111	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
112	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
113	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
114	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			422
115	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
116	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			386
117	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336

5

10

15

20

25

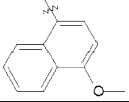
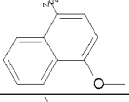
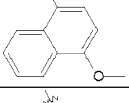
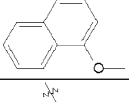
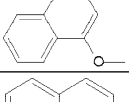
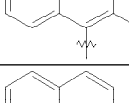
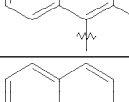
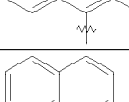
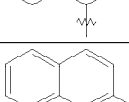
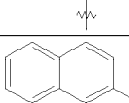
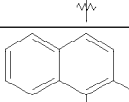
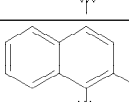
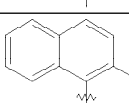
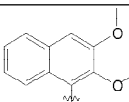
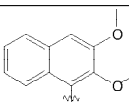
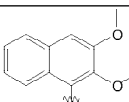
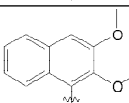

30

35

40

45

50

118	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		403
119	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		382
120	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H		396
121	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H		400
122	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		364
123	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		366
124	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H		335
125	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		350
126	A2	S	Me	H	H	O	H	H		352
127	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H		422
128	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		368
129	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		386
130	A1	O	Me	H	H	O	H	H		336
131	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		403
132	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		396
133	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H		365
134	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		380
135	A2	S	Me	H	H	O	H	H		382

5

10

15

20

25

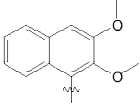
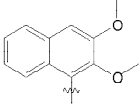
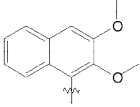
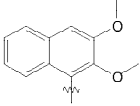
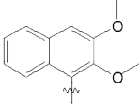
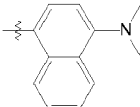
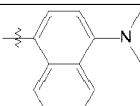
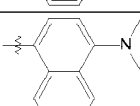
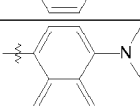
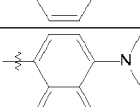
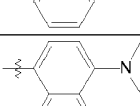
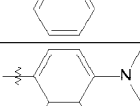
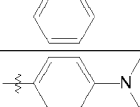
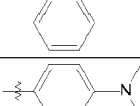
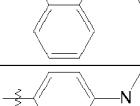
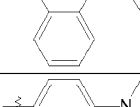
30

35

40

45

50

136	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H		452
137	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		398
138	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		416
139	A1	O	Me	H	H	O	H	H		366
140	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		433
141	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		379
142	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H		348
143	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		363
144	A2	S	Me	H	H	O	H	H		365
145	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H		435
146	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		381
147	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		399
148	A1	O	Me	H	H	O	H	H		349
149	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		416
150	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		395
151	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H		409

5

10

15

20

25

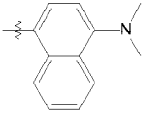
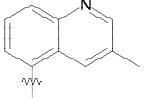
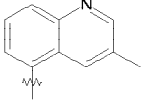
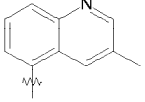
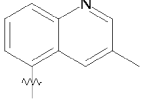
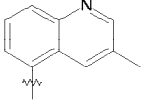
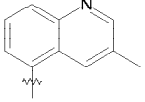
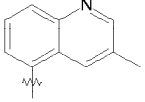
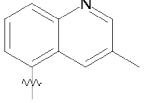
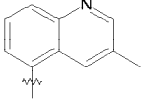
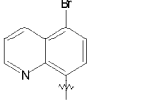
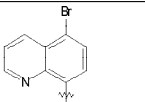
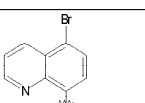
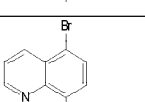
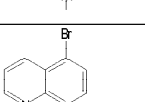
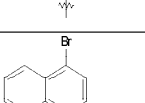
30

35

40

45

50

152	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			413
153	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			351
154	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			320
155	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			335
156	A2	S	Me	H	H	O	H	H			337
157	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			407
158	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			353
159	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			371
160	A1	O	Me	H	H	O	H	H			321
161	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			388
162	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			415
163	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			384
164	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			399
165	A2	S	Me	H	H	O	H	H			401
166	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			471
167	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,9	

5

10

15

20

25

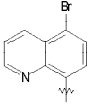
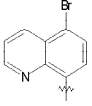
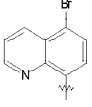
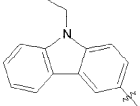
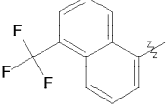
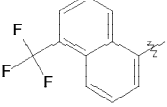
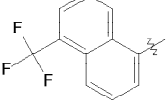
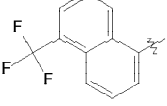
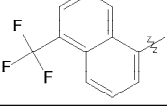
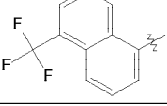
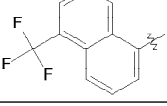
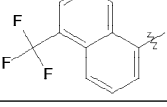
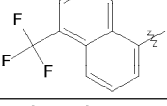
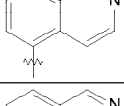
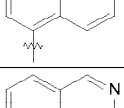
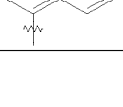
30

35

40

45

50

168	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		435
169	A1	O	Me	H	H	O	H	H		385
170	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		452
171	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		405
172	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		404
173	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H		373
174	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		388
175	A2	S	Me	H	H	O	H	H		390
176	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H		460
177	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		406
178	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		424
179	A1	O	Me	H	H	O	H	H		374
180	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H		441
181	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		337
182	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H		306
183	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		321

5

10

15

20

25

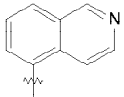
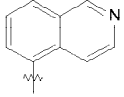
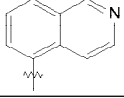
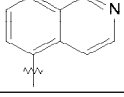
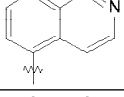
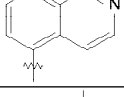
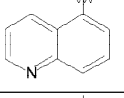
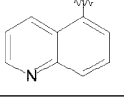
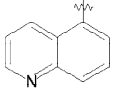
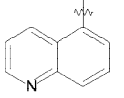
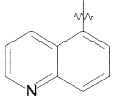
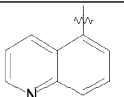
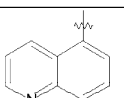
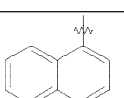
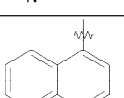
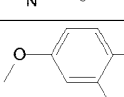
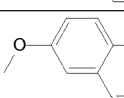
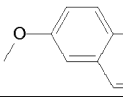
30

35

40

45

50

184	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
185	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
186	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
187	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
188	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
189	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
190	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
191	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
192	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
193	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
194	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
195	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
196	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
197	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
198	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
199	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
200	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
201	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350

5

10

15

20

25

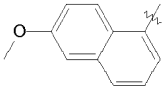
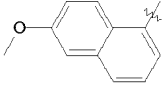
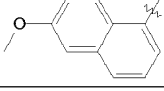
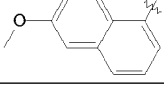
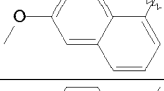
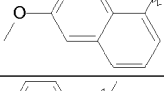
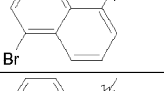
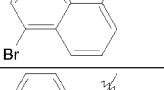
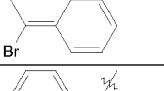
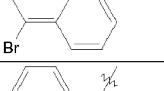
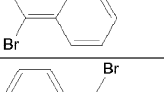
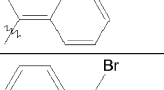
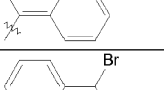
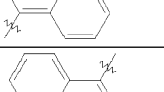
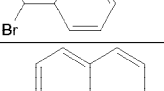
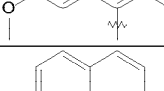
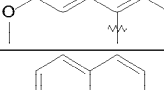
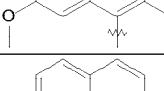
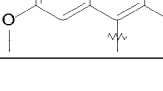
30

35

40

45

50

202	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
203	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			422
204	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
205	A6	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			386
206	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
207	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
208	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
209	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			383
210	1	O	Me	H	Me	O	H	H			398
211	A2	S	Me	H	H	O	H	H			400
212	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			470
213	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
214	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			434
215	A1	O	Me	H	H	O	H	H			384
216	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			451
217	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
218	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
219	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
220	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382

5

10

15

20

25

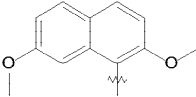
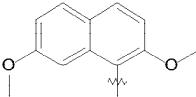
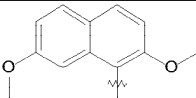
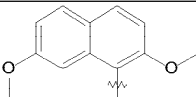
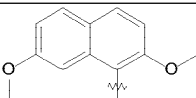
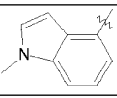
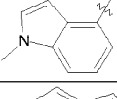
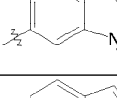
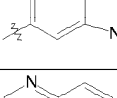
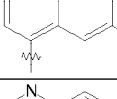
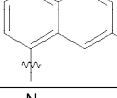
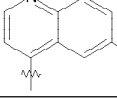
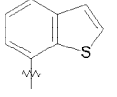
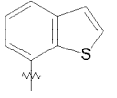
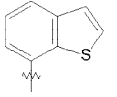
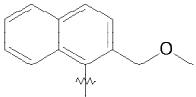
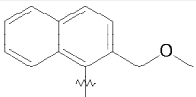
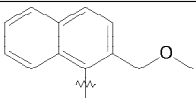
30

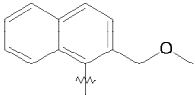
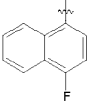
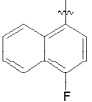
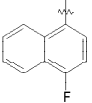
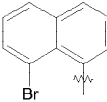
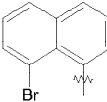
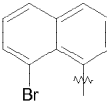
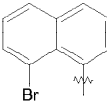
35

40

45

50

221	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
222	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,96	
223	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
224	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
225	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433
226	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
227	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
228	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
229	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
230	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			373
231	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			387
232	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			355
233	A5	N-Me	Me		F	O	H	H			344
234	A5	N-Me	Et		F	O	H	H			358
235	A5	N-Me	CHF ₂		H	O	H	H			362
236	A5	N-Me	Me		F	O	H	H			382
237	A5	N-Me	Et		F	O	H	H			396
238	A5	N-Me	CHF ₂		H	O	H	H			400

5	239	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			364
	240	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			370
	241	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			388
10	242	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			384
15	243	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
	244	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			430
20	245	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			434
25	246	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			398

Общий пример получения 1: получение производного амида формулы (I) в микроволновом аппарате Optimizer™

Во флакон Optimizer™ объемом 8 мл взвешивают 1,7 ммоль амина (II). Добавляют 2 мл 1-молярного раствора ацилхлорида (III) (2 ммоль) в ацетонитриле с последующим добавлением 1 мл триэтиламина. Флакон закрывают крышкой с уплотнением, сначала перемешивают в течение 10 с при окружающей температуре, затем нагревают при 180°C в течение 60 с микроволнами. После охлаждения флакон открывают и выливают в 10 мл насыщенного раствора карбоната калия. Водный слой удаляют дважды 5 мл дихлорметана. Органические фазы сушат над сульфатом магния. Растворители удаляют и неочищенный амид анализируют ЖХМС и ЯМР. Недостаточно чистые соединения дополнительно очищают препаративной ЖХМС.

Общий пример получения 2: тионирование производного амида формулы (I) на аппарате Chemspeed™

Во флаконы Chemspeed™ объемом 13 мл взвешивают 0,27 ммоль пентасульфида фосфора (P₂S₅). Добавляют 3 мл 0,18 молярного раствора амида (I) (0,54 ммоль) в диоксане и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение двух часов. Затем температуру понижают до 80°C и добавляют 2,5 мл воды. Смесь нагревают при 80°C в течение еще одного часа. Затем добавляют 2 мл воды и реакционную смесь извлекают дважды 4 мл дихлорметана. Органическую фазу осаждают на картридж из щелочного оксида алюминия (2 г) и элюируют дважды 8 мл дихлорметана. Растворители удаляют и неочищенный тиамида анализируют ЖХМС и ЯМР. Недостаточно чистые соединения дополнительно очищают препаративной ЖХМС.

Пример действия A: in vivo профилактический тест на *Pyrenophora teres* (сетчатая пятнистость ячменя)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО, затем разбавляют водой с получением желаемой концентрации активного вещества.

5 Растения ячменя (экспресс сорт) в чашках для разведения, посеянные на субстрате 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1 листа (10 см высотой) путем обрызгивания активным ингредиентом, полученным, как описано выше. Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают смесью ацетон/твин/ДМСО/вода, не содержащей активное
10 вещество.

Через 24 часа растения заражают путем разбрызгивания на них водной суспензии спор *Ryzenophora teres* (12000 спор в 1 мл). Споры собирают с 15-дневной культуры. Зараженные растения ячменя инкубируют в течение 24 часов при приблизительно 20°C и при относительной влажности 100% и затем в течение 12 дней при относительной
15 влажности 80%.

Оценку осуществляют через 12 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях, при дозе 500 ч./млн., хорошая (по меньшей мере 70%) или
20 полная защита наблюдается со следующими соединениями: 1, 2, 3, 6, 8, 9, 11, 12, 16, 18, 24, 25, 26, 27, 33, 36, 40, 42, 47, 50, 54, 55, 57, 58, 59, 64, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 109, 116, 119, 120, 145, 149, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 204, 213, 214, 222, 226, 227, 228, 240, 241 и 242.

25 Пример действия В: *in vivo* профилактический тест на *Sphaerotheca fuliginea* (тыквенная порошкообразная плесень)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО, затем разбавляют водой, с получением желаемой концентрации активного вещества.

30 Растения корншоно (сорт Vert petit de Paris) в чашках для разведения, посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 20°C/23°C, обрабатывают на стадии 2 первых листьев путем обрызгивания описанной выше водной суспензией. Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают смесью ацетон/твин/ДМСО/вода, не содержащей активное вещество.

35 Через 24 часа растения заражают путем разбрызгивания на них водной суспензии спор *Sphaerotheca fuliginea* (100000 спор в мл). Споры собирают с зараженных растений. Зараженные растения корншоно инкубируют при приблизительно 20°C/25°C и при относительной влажности 60/70%.

40 Оценку (% действия) проводят через 11-12 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях, при дозе 500 ч./млн. наблюдается хорошая (по меньшей мере, 70%) или полная защита со следующими соединениями: 2, 6, 8, 11, 12, 17, 18, 22, 23, 25, 26, 36, 40, 41, 42, 47, 49, 50, 51, 53, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 66, 67, 69,
45 70, 71, 72, 74, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 105, 109, 120, 128, 129, 136, 137, 138, 149, 157, 158, 159, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 180, 185, 194, 195, 196, 198, 204, 205, 221, 222, 240, 241 и 242.

50 Пример действия С: *in vivo* профилактический тест на *Mycosphaerella graminicola* (пятнистость листьев пшеницы)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО и затем разбавляют водой с получением желаемой концентрации активного вещества.

Растения пшеницы (сорт Scipion), посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф в чашках для разведения и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1 листа (10 см высотой) путем обрызгивания активным ингредиентом, полученным, как описано выше. Растения, используемые в качестве контроля,

обрабатывают смесью ацетон/твин/ДМСО/вода, не содержащей активное вещество. Через 24 часа растения заражают путем обрызгивания их водной суспензией спор *Mycosphaerella graminicola* (500000 спор в 1 мл). Споры собирают у 7-дневной культуры, зараженные растения пшеницы инкубируют в течение 72 часов при 18°C и при относительной влажности 100% и затем в течение 21-28 дней при относительной влажности 90%.

Оценку (% действия) проводят через 21-28 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях при дозе 500 ч./млн. наблюдается хорошая (по меньшей мере 70%) или полная защита со следующими соединениями: 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 17, 18, 22, 23, 24, 26, 27, 32, 33, 34, 36, 40, 41, 47, 48, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 67, 69, 70, 71, 74, 75, 79, 80, 81, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 96, 97, 100, 105, 109, 115, 116, 119, 120, 128, 129, 134, 136, 137, 138, 140, 145, 146, 147, 149, 155, 157, 158, 161, 164, 166, 167, 168, 170, 172, 174, 176, 177, 178, 180, 183, 185, 186, 187, 190, 192, 194, 195, 221, 225, 226, 227, 228, 229, 240, 241 и 242.

Пример действия D: *in vivo* тест на *Puccinia reconditaf. sp. tritici* (коричневая ржавчина пшеницы).

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО, затем разбавляют водой с получением желаемой концентрации активного вещества.

Растения пшеницы (сорт Scipion) в чашках для разведения, посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1 листа (10 см высотой) путем обрызгивания активным ингредиентом, полученным, как описано выше. Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают смесью ацетон/твин/ДМСО/вода, не содержащей активное вещество.

Через 24 часа растения заражают путем обрызгивания листьев водной суспензией спор *Puccinia recondita* (100000 спор в 1 мл). Споры собирают у 10-дневной зараженной пшеницы и суспендируют в воде, содержащей 2,5 мл/л 10%-ного твина 80. Зараженные растения пшеницы инкубируют в течение 24 часов при 20°C и при относительной влажности 100% и затем в течение 10 дней при 20°C и относительной влажности 70%.

Оценку проводят через 10 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях при дозе 500 ч./млн. наблюдается хорошая (по меньшей мере 70%) или полная защита со следующими соединениями: 1, 2, 9, 16, 24, 25, 26, 36, 47, 49, 54, 57, 58, 63, 64, 65, 66, 67, 80, 83, 85, 87, 88, 89, 94, 100, 109, 119, 120, 134, 136, 137, 138, 140, 149, 158, 167, 176, 177, 178, 240 и 242.

Пример E: *in vivo* тест на *Alternaria brassicae* (пятнистость листьев crucifers)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО, и затем разбавляют водой, с получением желаемого активного вещества.

Растения редиски (сорт Pernot) в чашках для разведения, посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 18-20°C, обрабатывают на стадии семядоли путем обрызгивания активным ингредиентом, полученным, как

описано выше.

Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают смесью ацетон/твин/вода, не содержащей активное вещество.

Через 24 часа растения заражают путем обрызгивания их водной суспензией спор *Alternaria brassicae* (40000 спор в 1 см³). Споры собирают у 12-13-дневной культуры.

Зараженные растения редиски инкубируют в течение 6-7 дней при приблизительно 18°C во влажной атмосфере.

Оценку проводят через 6-7 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях хорошая защита (по меньшей мере 70 %) наблюдается в дозе 500 ч./млн. со следующими соединениями: 2, 6, 12, 16, 18, 26, 47, 49, 57, 65, 66, 67, 69, 79, 80, 83, 166, 167, 176, 204, 213, 214 и 240.

Пример F: *in vivo* тест на *Botrytis cinerea* (серая плесень)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО, затем разбавляют водой с получением желаемого активного вещества.

Растения корншона (сорт Vert petit de Paris), посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф в чашках для разведения и выращенные при 18-20°C, обрабатывают на стадии семядоли Z11 путем обрызгивания активным ингредиентом, полученным, как описано выше.

Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают водным раствором, не содержащим активного вещества. Через 24 часа растения заражают путем нанесения капель водной суспензии спор *Botrytis cinerea* (150000 спор в 1 мл) на верхнюю поверхность листьев. Споры собирают с 15-дневной культуры и суспендируют в питательном растворе, составленном из

20 г/л желатина;
50 г/л D-фруктозы;
2 г/л NH₄NO₃;
1 г/л KН₂PO₄.

Зараженные растения огурца выдерживают в течение 5-7 дней в комнате с климатическим контролем при 15-11°C (день/ночь) и при относительной влажности 80%.

Оценку проводят через 5-7 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями. В указанных условиях при дозе 500 ч./млн. наблюдается хорошая (по меньшей мере 70%) защита со следующими соединениями: 36, 64, 65, 67, 80 и 89.

Примера G: *in vivo* тест на *Peronospora parasitica* (пушистая плесень крестоцветных)

Тестируемые активные ингредиенты получают путем гомогенизации смеси ацетон/твин/ДМСО и затем разбавляют водой с получением желаемого активного вещества.

Растения капусты (сорт Eminence) в чашках для разведения, посеянные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 18-20°C, обрабатывают на стадии семядоли путем разбрызгивания описанной выше водной суспензией. Растения, используемые в качестве контроля, обрабатывают водным раствором, не содержащим активного вещества. Через 24 часа растения заражают путем обрызгивания их водной суспензией спор *Peronospora parasitica* (50000 спор в 1 мл). Споры собирают у зараженного растения. Зараженные растения капусты инкубируют в течение 5 дней при 20°C во влажной атмосфере. Оценку проводят

через 5 дней после заражения, сравнивая с контрольными растениями.

В указанных условиях при дозе 500 ч./млн. наблюдается от хорошей (по меньшей мере 70% борьбы с заболеванием) до полной защиты (100% борьбы с заболеванием) со следующими соединениями: 2, 6, 8, 19, 27, 48, 49, 57, 73, 75, 83, 84, 87, 88, 94, 99, 108, 109, 129, 134, 135, 136, 149, 155, 164, 169, 174, 176, 179, 183, 198, 219 и 240 по настоящему изобретению, тогда как от слабой защиты (менее 30% борьбы с заболеванием) до отсутствия защиты наблюдается при дозе 500 ч./млн. с соединениями примеров 5, 45 и 50, раскрытыми в патентной заявке WO-2006/120224.

Примеры 5, 45 и 50, раскрытые в патентной заявке WO-2006/120224, соотносятся соответственно со следующими соединениями:

N-циклопропил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-2,5-диметил-фуран-3-карбоксамид;

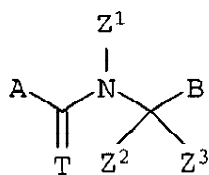
N-циклопропил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-5-фтор-1,3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксамид;

N-циклопропил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-5-фтор-3-(трифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид.

Данные результаты показывают, что соединения по настоящему изобретению обладают намного лучшим биологическим действием, чем структурно наиболее близкие соединения, раскрытые в WO-2006/120224.

Формула изобретения

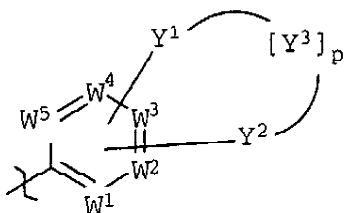
1. Соединение формулы (I)



(I)

где А представляет собой присоединенную через атом углерода, ненасыщенную или частично насыщенную 5-членную гетероциклическую группу, выбранную из тиюфенила, фуранила, пиразолила и пирролила, которая может быть замещена от одной до трех R^a группами;

В представляет собой



где W¹-W⁵ независимо представляют N или CR^{b1};

Y¹-Y³ независимо представляют N, S, NR^{b2} или CR^{b3};

Y¹-Y³ вместе с атомами Wⁿ, к которым они присоединены, образуют ароматическое 5-членное конденсированное гетероциклическое кольцо, включающее в качестве гетероатомов атомы S или N, ароматическое 6-членное конденсированное гетероциклическое кольцо, содержащее в качестве гетероатома атом N или ароматическое 6-членное конденсированное карбоциклическое кольцо,

р равен 1 или 2;

Т представляет собой О или S;

Z¹ представляет собой незамещенный циклопропил;

Z² представляет собой атом водорода, C₁-C₈алкил или C₁-C₈алкоксикарбонил;

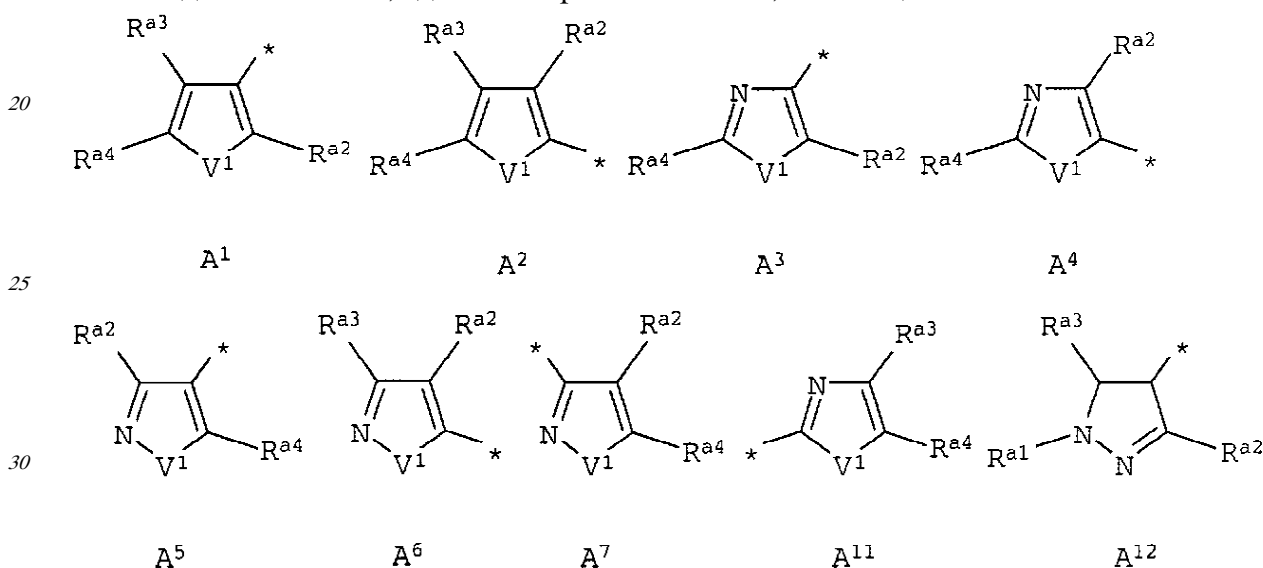
5 Z³ независимо представляют собой атом водорода;

R^a независимо представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; или C₁-C₈алкокси;

10 R^{b1} и R^{b3} независимо представляют собой атом водорода; атом галогена; нитро; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; ди(C₁-C₈алкил)амино; C₁-C₈алкокси или C₁-C₈алкокси-C₁-C₈алкил;

15 R^{b2} представляет собой C₁-C₃алкил;
а также его соли.

2. Соединение по п.1, где А выбирают из списка, состоящего из:



35 где *представляет собой точку присоединения к карбонильному фрагменту;

V¹ представляет собой О, S или NR^{a1}, когда А представляет собой А¹ или А²;

V¹ представляет собой NR^{a1}, когда А представляет собой А³, А⁴, А⁵, А⁶, А⁷, А¹¹ или А¹²;

40 R^{a1} представляет собой атом водорода; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

45 R^{a2} и R^{a3}, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₈алкокси;

50 R^{a4} представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

3. Соединение по п.п.2, где

R^{a1} представляет собой атом водорода; C₁-C₈алкил;

R^{a2} представляет собой C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 3 атомов

галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 алкокси;

R^{a3} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил;

R^{a4} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 -

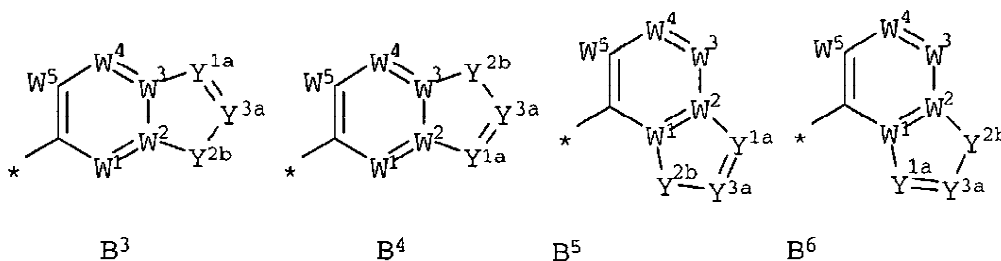
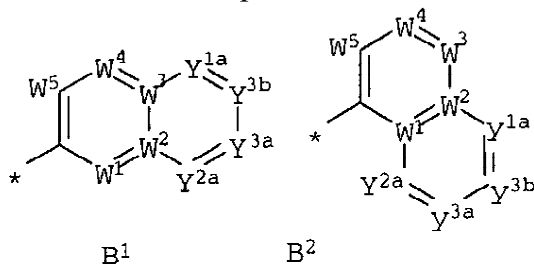
C_8 галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

4. Соединение по п.2 или 3, где

A представляет собой A^5 ;

R^{a1} представляет собой C_1 - C_8 алкил.

5. Соединение по п.1, где B выбирают из списка, состоящего из:



где W^1 - W^5 независимо представляют собой N или CR^{b1} ;

Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} и Y^{3b} независимо представляют собой NR^{b2} или CR^{b3} ;

Y^{2b} представляет собой S или NR^{b2} .

6. Соединение по п.5, где

B представляет собой B^1 или B^2 ;

W^1 - W^5 независимо представляют собой CR^{b1} ;

Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} и Y^{3b} независимо представляют собой CR^{b3} ; или

B представляет собой B^5 или B^6 ;

W^1 - W^5 независимо представляют собой CR^{b1} ;

Y^{1a} и Y^{3a} независимо представляют собой CR^{b3} ;

Y^{2b} представляет собой S.

7. Соединение по пп.1, 2, 3, 5 или 6 где Z^2 представляет собой атом водорода или C_1 - C_8 алкил.

8. Фунгицидная композиция, содержащая в качестве активного ингредиента эффективное количество соединения формулы (I) по пп.1-7 и приемлемые с точки зрения сельского хозяйства подложку, носитель или наполнитель.

9. Способ борьбы с фитопатогенными грибами у сельскохозяйственных растений, включающий нанесение агрономически эффективного и, по существу, нефитотоксичного количества соединения по пп.1-7 или композиции по п.8 на почву, где растут растения или могут расти, на листья и/или плоды растений или на семена растений.