

R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2



(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 ЕР 07356105.2
16.04.2008 ЕР 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:
ЕР 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 Городисский и
Партнеры", пат.пov. 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

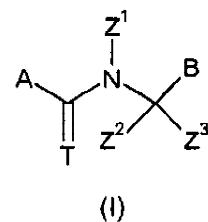
(57) Реферат:

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,

R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2

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.



R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2

R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2

R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2



(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.Spasskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoy

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

(51) Int. Cl.
C07D 207/34 (2006.01) *A01N 43/08* (2006.01)
C07D 231/20 (2006.01) *A01N 43/10* (2006.01)
C07D 231/14 (2006.01) *A01N 43/36* (2006.01)
C07D 231/16 (2006.01) *A01N 43/56* (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 307/56 (2006.01)
C07D 333/38 (2006.01)

(72) Inventor(s):

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

(73) Proprietor(s):

BAJER KROPSAJENS AG (DE)

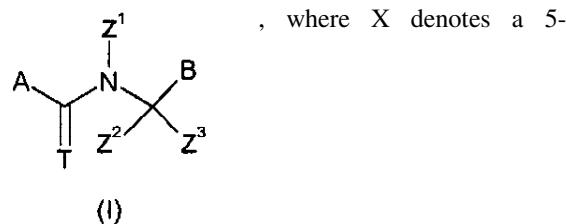
R U 2 4 4 0 9 8 2 C 2

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

(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to compounds of general formula



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.

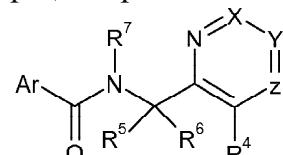
9 cl, 3 dwg, 255 ex

5 Настоящее изобретение относится к производным N-(ароматического 6-членного конденсированного (гетеро)арилметилен)-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-пиридилилметиленгетероцикликамида.

10 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 GABAА, имеющие следующую формулу:

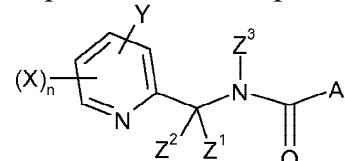


где Ar может представлять собой 5-10-членный гетероцикл, R⁷ может представлять

20 собой C₃-C₇циклоалкил, в то время как X, Y и Z могут представлять собой N или CR¹, 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.

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

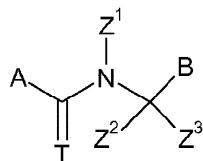


в котором нет какого-либо указания на получение фунгицидных бициклических производных согласно настоящему изобретению.

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

40 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.

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



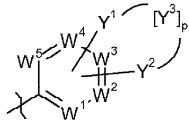
5

(I)

где А представляет собой присоединенную через атом углерода, ненасыщенную или частично насыщенную 5-членную гетероциклическую группу, которая может быть замещена вплоть до четырех R^a группами;

10

В представляет собой



15

где W^1-W^5 независимо представляют собой N или CR^{b1} ; Y^1-Y^3 независимо представляют собой N, O, S, NR^{b2} или CR^{b3} ;

Y^1-Y^3 вместе с атомами W^n , к которым они присоединены, образуют ароматическое 5- или 6-членное конденсированное гетероциклическое кольцо, 20 включающее до четырех гетероатомов, или ароматическое 6-членное конденсированное карбоциклическое кольцо;

20

р равен 1 или 2;

25

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

25

Z^1 представляет собой незамещенный C_3-C_7 циклоалкил или C_3-C_7 циклоалкил, 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; C_1-C_8 алкила; C_1-C_8 галогеналкила, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1-C_8 алкокси; C_1-C_8 галогеналкокси, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1-C_8 алкоксикарбонила; C_1-C_8 галогеналкоксикарбонила, включающего до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1-C_8 алкиламинокарбонила; ди(C_1-C_8 алкил)аминокарбонила;

35

Z^2 и Z^3 независимо 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; C_2-C_8 алкенил; C_2-C_8 алкинил; циано; нитро; C_1-C_8 алкокси; C_2-C_8 алкенилокси; C_2-C_8 алкинилокси; C_3-C_7 циклоалкил; C_1-C_8 алкилсульфенил; амино; C_1-C_8 алкиламино; ди(C_1-C_8 алкил)амино; C_1-C_8 алкоксикарбонил; C_1-C_8 алкилкарбонил; C_1-C_8 алкилкарбамоил; ди(C_1-C_8 алкил)карбамоил; $N-C_1-C_8$ алкил- C_1-C_8 алкоксикарбамоил или

45

Z^2 и Z^3 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, могут образовывать замещенный или незамещенный C_3-C_7 циклоалкил;

50

R^a независимо представляет собой атом водорода; атом галогена; циано; нитро; амино; сульфенил; гидроксил; пентафтор- λ -6-сульфенил; C_1-C_8 алкиламино; ди(C_1-C_8 алкил)амино; три(C_1-C_8 алкил)силил; три(C_1-C_8 алкил)силил C_1-C_8 алкил; 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 алкил; C_1-C_8 галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или

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; (гидроксимино)-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-С₈алкиламиноокарбонилокси; ди(С₁-С₈алкил)аминоокарбонилокси; С₁-С₈алкилоксикарбонилокси; С₁-С₈алкоксимино; (С₁-С₈алкоксимино)-С₁-С₈алкил; (С₁-С₈алкенилоксимино)-С₁-С₈алкил; (С₁-С₈алкинилоксимино)-С₁-С₈алкил; (бензилоксимино)-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; 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;

30 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-С₇галогенциклоалкил, 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;

45 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)алкилилил и три(С₁-С₈)алкилилил-С₁-С₈алкил; С₁-С₈алкоксимино; (С₁-С₈алкоксимино)-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-циклогексил-N-((6,8-диметил-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклогексил-N-((6-этокси-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклогексил-N-((6-метил-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-3-ил)метил)фуран-2-карбоксамида, N-циклогексил-N-((7,8-дифтор-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-4-ил)метил)-4-метилтиазол-5-карбоксамида и N-циклогексил-N-((8-фтор-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-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 15 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;

20 гетероатомом может быть азот, кислород или сера;

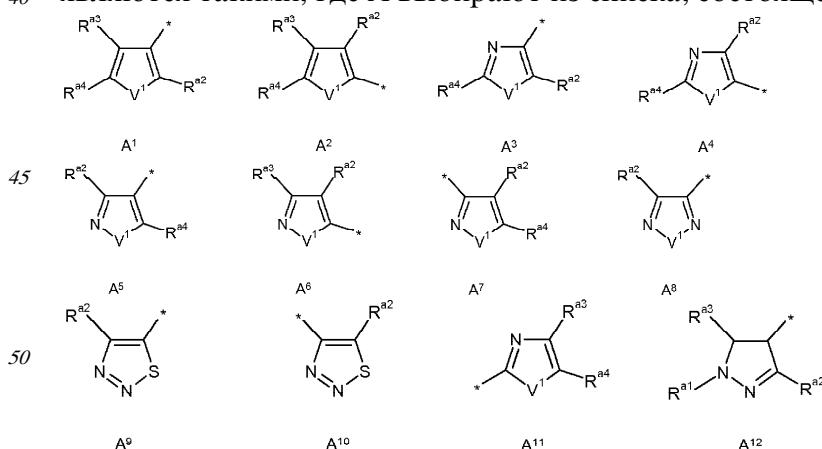
галогензамещенные группы, особенно галогеналкил, галогеналкокси и циклоалкильные группы, могут включать до девяти одинаковых или различных атомов галогена;

25 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]галогеналкокси, [C₁-C₆]галогеналкокси и [C₁-C₄]галогеналкокси-[C₁-C₄]алкила.

30 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.

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



где * представляет собой точку присоединения к карбонильному фрагменту;

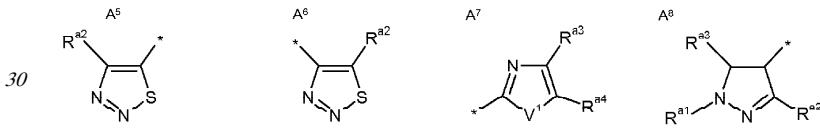
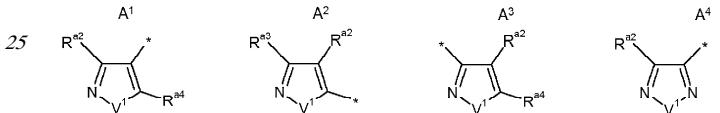
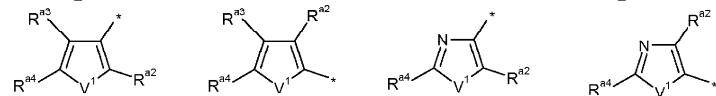
5 V^1 представляет собой O, S или NR^{a1} ;

6 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 5 различными; C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил;

10 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;

15 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.

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



где * представляет собой точку присоединения к карбонильной группе;

35 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;

36 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;

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

45 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

50 А представляет собой A^5 ;

V^1 представляет собой NR^{a1} ;

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

55 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

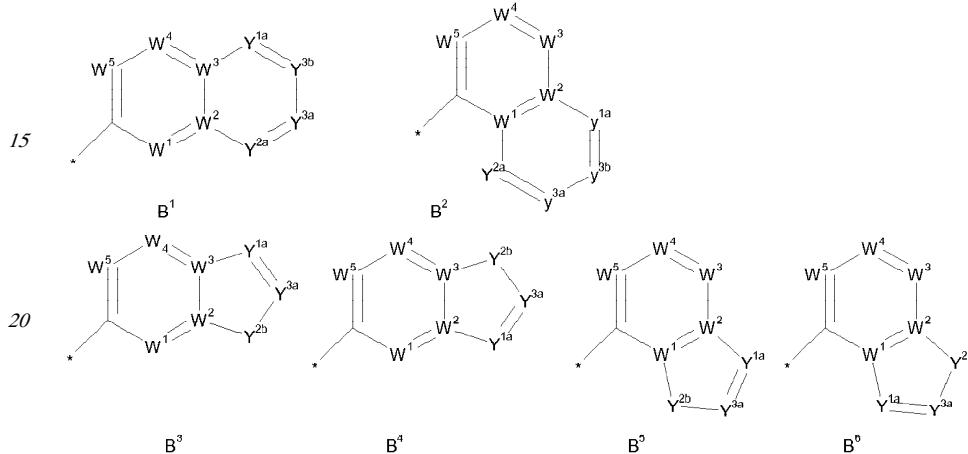
А представляет собой A⁴;

V¹ представляет собой S;

5 R^{a2} представляет собой C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{a4} представляет собой атом водорода; C₁-C₈алкил; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

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



25 где W¹-W⁵, 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}.

30 Другие более предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где В представляет собой B¹ или B²; W¹-W⁵, Y^{1a}, Y^{2a}, Y^{3a} и Y^{3b} независимо представляют собой CR^{b3}, или В представляет собой B⁵ или B⁶; W¹-W⁵, 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 Т представляет собой O или S.

35 Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где Z¹ представляет собой циклопропил.

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению являются такими, где Z² и Z³ независимо представляют собой атом водорода или C₁-C₈алкил.

40 Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению, являются такими, где Q представляет собой атом галогена; C₁-C₈алкил; C₁-C₈алкокси; C₁-C₈галогеналкил, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈галогеналкокси, включающий до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

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

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

предпочтительные значения Z^1 с предпочтительными значениями одного или более из $A, T, Z^2, Z^3, R^a, R^b, V^1$ и Q ;

предпочтительные значения Z^2 с предпочтительными значениями одного или более из $A, T, Z^1, Z^3, R^a, R^b, V^1$ и Q ;

предпочтенные значения Z^3 с предпочтительными значениями одного или более из $A, T, Z^1, Z^2, R^a, R^b, V^1$ и Q ;

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

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

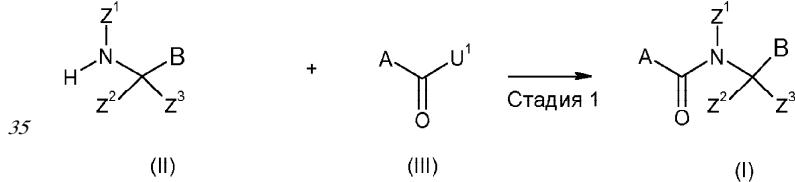
предпочтительные значения V^1 с предпочтительными значениями одного или более из A, T, Z^1-Z^3, R^a, R^b и Q ;

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

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

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

Таким образом, согласно дополнительному аспекту настоящего изобретения
30 предложен способ Р1 получения соединения формулы (I), где Т представляет собой О, как проиллюстрировано следующей схемой реакции:



Способ Р1

где A , Z^1-Z^3 , W^1-W^5 и B являются такими, как определено в настоящем описании;
 U^1 представляет собой атом галогена или уходящую группу.

В способе Р1 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 Р1 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 алкооксиды 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 trimетиламин, триэтиламин, дизопропилэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиламилидин, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинпиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклоонен (DBN) или диазабициклоундекен (DBU). Также возможно 15 работать при отсутствии дополнительного конденсирующего агента или использовать избыток аминного компонента, чтобы он одновременно действовал в качестве связующей кислоты.

Подходящие растворители для осуществления способа Р1 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 дизопропиловый 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, 25 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.

30 При осуществлении способа Р1 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 40 микроволновой технологии.

Способ Р1 согласно настоящему изобретению, как правило, независимо осуществляют при атмосферном давлении. Однако в каждом случае также возможно работать при повышенном или пониженном давлении.

45 При проведении стадии 1 способа Р1 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.

50 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 Р2 получения соединения формулы (I), где Т представляет собой S, и проиллюстрированный на следующей схеме реакции:



10 Способ Р2 где A, Z¹-Z³, W¹-W⁵ и В являются такими, как определено в настоящем описании.

Способ Р2 можно осуществлять в присутствии тионирующего агента.

15 Исходные производные амида, имеющие формулу (I), можно получить согласно способу Р1.

Подходящие тионирующие агенты для осуществления способа Р2 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), 20 фосфористым пентасульфидом (P₂S₅), реагентом Лоуссона (2,4-бис(4-метоксифенил)-1,2,3,4-дитиадифосфетан-2,4-дисульфид) или тионирующим агентом на полимерной подложке, таким как описано в *J.Chem.Soc.Perkin 1, (2001), 358*.

Способ Р2 можно осуществлять в присутствии или в отсутствие катализитического 25 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, 30 пиколин, 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 Р2 согласно настоящему изобретению могут быть общепринятыми инертными органическими растворителями. 35 Предпочтительно использовать необязательно галогензамещенные алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как простой петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксиол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, четыреххлористый углерод, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как простой диэтиловый 40 эфир, простой диизопропиловый эфир, простой метил-трет-бутиловый эфир, простой метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксистан или 1,2-диэтоксистан; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, н- или изобутиронитрил или бензонитрил; серные растворители, такие как сульфолан или 45 дисульфид углерода.

При осуществлении способа Р2 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 50 настоящему изобретению состоит в применении микроволновой технологии.

Способ Р2 согласно настоящему изобретению, как правило, независимо осуществляют при атмосферном давлении. Однако в каждом случае, также возможно работать при повышенном или пониженном давлении.

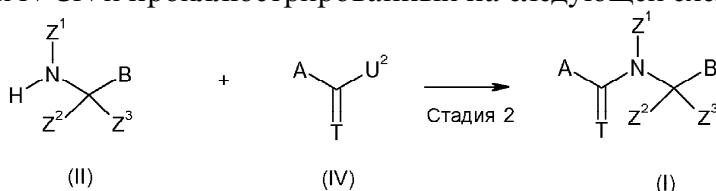
При осуществлении способа Р2 согласно настоящему изобретению 1 моль или избыток серы, эквивалентный тионирующему агенту, и 1-3 моля основания можно использовать на 1 моль производного амида (I).

Также возможно использовать компоненты реакции в других соотношениях.

5 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 10 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, Z^1-Z^3 , W^1-W^5 и В являются такими, как определено в настоящем описании; U^2 представляет собой атом хлора или метилсульфанильную группу,

25 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 30 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).

35 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.

40 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.

45 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 50 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-диметиламилини, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинопиридин, 5 диазабициклооктан (DABCO), диазабициклоонен (DBN) или диазабициклоундекен (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 Р3 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, ксиол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, четыреххлористый углерод, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как простой диэтиловый эфир, простой дизопропиловый эфир, простой метил-трет-бутиловый эфир, простой 20 метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксистан, 1,2-диэтоксистан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, н- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанид, N-метилпирролидон или 25 гексаметилфосфорный триамид; сложные эфиры, такие как сложный метилацетат или этилацетат, сульфоксиды, такие как диметилсульфоксид, или сульфоны, такие как сульфолан.

При осуществлении способа Р3 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 Р3 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 Р3 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 Р3 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).

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.

5 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 10 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 15 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.

20 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 25 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.

30 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.

35 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 40 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 45 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 50 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 нукleinовой кислоты, например беналаксил, беналаксил-М, бупирамат, клозилакон, диметиримол, этиримол, фуралаксил, гимексазол, металаксил, металаксил-М, офурас, оксадиксил и оксолиновая кислота.

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

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

качестве ингибитора СП-дыхания.

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

(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, мепанипирил и пираметанил.

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

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

(9) Ингибиторы биосинтеза эргостерола, например альдиморф, азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, диклобутразол, дифеноконазол, диниконазол, диниконазол-М, додеморф, ацетат додеморфа, эпоксиконазол, этаконазол, фенаримол, фенбуконазол, фенгексамид, фенпропидин, фенпропиморф, флуквинконазол, флурпримидол, флузиазол, 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, спироксамин, 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, манкозеб, манеб, метирам, цинк метирам, оксин-медь, пропамидин, пропинеб, 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(3Н)-он, этил (2Z)-3-амин-2-циано-3-фенилпроп-2-эноат, N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1, 3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, N-{2-[1,1'-би(циклогексил)-2-ил]фенил}-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид,

(2E)-2-(2-{[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпиримидин-4-ил]окси}фенил)-2-

(метоксиимино)-N-метилэтанамид,
 (2E)-2-{2-[{{(2E,3E)-4-(2,6-дихлорфенил)бут-3-ен-2-илиден]амин}окси}метил]фенил}-
 2-(метоксиимино)-N-метилэтанамид,
 5 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1Н-инден-4-ил)пиридин-3-карбоксамид,
 N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-(формиламин)-2-гидроксибензамид,
 10 5-метокси-2-метил-4-{2-[{{(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилен}амин}окси]}-
 метил}фенил)-2,4-дигидро-3Н-1,2,4-триазол-3-он,
 (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-{2-[{{(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилен}окси]}-
 10 амин}метил}фенил)этанамид,
 (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-{2-[{E}-{{1-[3-(трифторметил)фенил]этокси}имино}метил]фенил}этанамид,
 15 (2E)-2-{2-[{{(1E)-1-(3-{{(E)-1-фтор-2-фенилэтенил}окси}фенил)этилен}амин}окси}метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилэтанамид,
 1-({4-хлорфенил)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)циклогептанол,
 метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигидро-1Н-инден-1-ил)-1Н-имиазол-5-карбоксилат,
 N-этил-N-метил-N'-{2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-(триметилсил)пропокси]}-
 20 фенил}имидоформамид,
 N'-{5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсил)пропокси]фенил}-N-этил-N-
 метилимидоформамид,
 O-{{1-[(4-метоксиленокси)метил]-2,2-диметилпропил}1Н-имиазол-1-карботиоат,
 N-[2-(4-{{3-(4-хлорфенил)проп-2-ин-1-ил}окси}-3-метоксиленил)этил]-N2-
 25 (метилсульфонил)валинамид,
 5-хлор-7-(4-метилпиперидин-1-ил)-6-(2,4,6-трифторменил)[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин,
 5-амин-1,3,4-тиадиазол-2-тиол, пропамокарб-фосетил,
 1-[(4-метоксиленокси)метил]-2,2-диметилпропил-1Н-имиазол-1-карбоксилат,
 30 1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-
 карбоксамид,
 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пиридин,
 2-бутокси-6-иод-3-пропил-4Н-хромен-4-он, 2-фенилфенол и соли,
 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]-1Н-пиразол-4-
 35 карбоксамид,
 3,4,5-трихлорпиперидин-2,6-дикарбонитрил,
 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметилизоксазолидин-3-ил]пиридин,
 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторменил)-6-метилпиридин,
 40 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторменил)-3,6-диметилпиридин,
 хинолин-8-ол, хинолин-8-ола сульфат (2:1) (соль), бентиазол,
 бетоксазин, капсимицин, карвон, хинометионат, хлоронеб,
 куфранеб, цифлуфенамид, цимоксанил, ципросульфамид, дазомет,
 45 дебакарб, дихлорофен, дикломезин, диклоран, дифензокват,
 метилсульфат дифензоквата, дифениламин, экомат, феримзон, флуметовер,
 флуопиколид, фторимид, флусульфамид, фосетил-алюминий, фосетил-кальций,
 фосетил-натрий, гексахлорбензол,
 50 ирумамицин, изотианил, метасульфокарб,
 метил (2E)-2-{2-{{(циклогептил[(4-метоксиленил)имино]метил}тио}метил}фенил}-3-
 метоксиакрилат,
 метилизотиоцианат, метрафенон,
 (5-бром-2-метокси-4-метилпиперидин-3-ил)(2,3,4-триметокси-6-метилфенил)метанон,

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,

⁵ 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)-[(циклогексилметокси)имино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил}-2-

¹⁰ фенилацетамид,

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

натамицин, диметилдитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил,

октилинон, оксамокарб, оксифентиин, пентахлорфенол и соли,

¹⁵ 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-1Н-пиразол-1-карботиоат, теклофталам, текназин, триазоксид, трихламид, 5-

²⁰ 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

²⁵ 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, ³⁵ 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 ⁴⁰ 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 plantins), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiceae 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 10 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 meibomiae*;
- 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, 40 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: 45 *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 заболевания *Ramularia*, вызываемые, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*;
- заболевания *Rhynchosporium*, вызываемые, например, *Rhynchosporium secalis*;
- заболевания *Septoria*, вызываемые, например, *Septoria apii* и *Septoria lycopersici*;
- ¹⁵ заболевания *Typhula*, вызываемые, например, *Thyphula incarnata*;
- заболевания *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 заболевания *Gaeumannomyces*, вызываемые, например, *Gaeumannomyces graminis*;
- заболевания *Rhizoctonia*, вызываемые, например, *Rhizoctonia solani*;
- заболевания *Sarocladium*, вызываемые, например, *Sarocladium oryzae*;
- заболевания *Sclerotium*, вызываемые, например, *Sclerotium oryzae*;
- ²⁵ заболевания *Tapesia*, вызываемые, например, *Tapesia acuformis*;
- заболевания *Thielaviopsis*, вызываемые, например, *Thielaviopsis basicola*;
- заболевания початков и метелки, включая кочерыжку кукурузного початка, такие как
- заболевания *Alternaria*, вызываемые, например, *Alternaria spp.*;
- ³⁰ заболевания *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 zaeae*;
- ³⁵ заболевания *Monographella*, вызываемые, например, *Monographella nivalis*;
- заболевания головней, такие как
- заболевания *Sphacelotheca*, вызываемые, например, *Sphacelotheca reiliana*;
- заболевания *Tilletia*, вызываемые, например, кариес *Tilletia*;
- ⁴⁰ заболевания *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 заболевания *Penicillium*, вызываемое, например, *Penicillium expansum* и *Penicillium purpurogenum*;
- заболевания *Rhizopus*, вызываемое, например, *Rhizopus stolonifer*;
- заболевания *Sclerotinia*, вызываемые, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;
- ⁵⁰ заболевания *Verticillium*, вызываемые, например, *Verticillium alboatrum*;
- 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 zaeae*;
 заболевания *Macrophomina*, вызываемые, например, *Macrophomina phaseolina*;
 заболевания *Microdochium*, вызываемые, например, *Microdochium nivale*;
 заболевания *Monographella*, вызываемые, например, *Monographella nivalis*;
 15 заболевания *Penicillium*, вызываемые, например, посредством *Penicillium expansum*;
 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*;
 25 заболевания *Sclerotium*, вызываемые, например, *Sclerotium rolfsii*;
 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
 заболевания *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, *Plamodiophora 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, 5 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, 10 прямое нанесение, разбрызгивание, окурение, 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 15 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 20 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 25 в обработке генетически модифицированных организмов соединениями по настоящему изобретению или агрохимическими композициями по настоящему изобретению. Генетически модифицированные растения являются растениями, в геном которых устойчиво введен гетерологический ген, кодирующий представляющий 30 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 35 получения композиции, полезной для лечения или профилактики грибковых заболеваний человека или животного, таких как, например, микозы, дерматозы, заболевания трихофитоном и кандидозы или заболевания, вызываемые *Aspergillus spp.*, например, *Aspergillus fumigatus*.

Различные аспекты настоящего изобретения будут проиллюстрированы в 40 следующей таблице примеров соединения и следующих примеров получения.

Следующая таблица неограничивающим образом иллюстрирует примеры соединений по настоящему изобретению.

В следующей таблице M+H (или M-H) означает пик молекулярных ионов плюс или 45 минус 1 а.е.м. (атомная единица массы) соответственно, как наблюдается в массовой спектроскопии, и M (Apcl+) 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 50 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

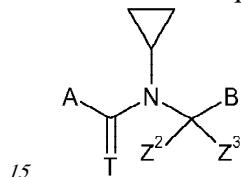
ацетонитрил; линейный градиент от 10% ацетонитрила до 90% ацетонитрила.

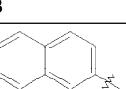
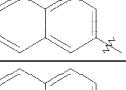
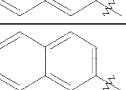
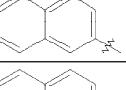
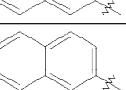
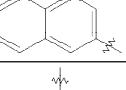
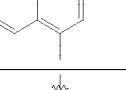
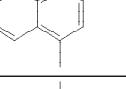
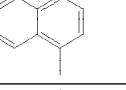
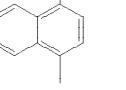
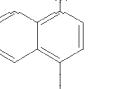
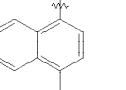
Калибровку выполняли с использование алкан-2-онов (включающих 3-16 атомов углерода) с известными значениями logP (определение значений logP по времени удерживания с линейной интерполяцией между двумя последовательными алканонами).

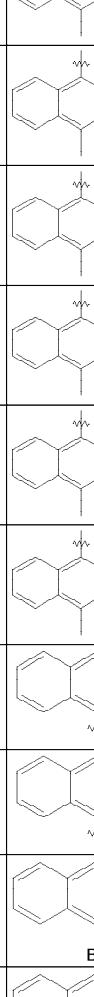
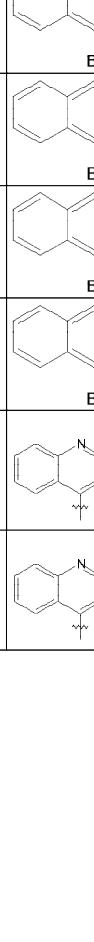
Максимальные значения лямбды определяли по максимумам хроматографических сигналов с применением УФ-спектров от 190 до 400 нм.

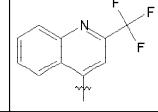
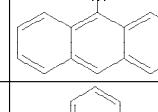
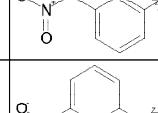
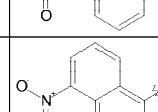
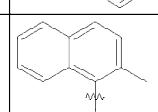
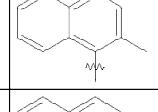
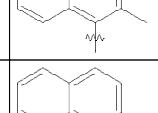
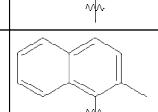
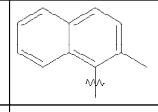
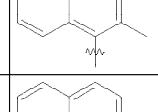
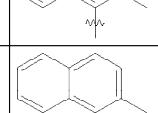
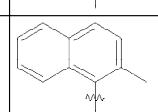
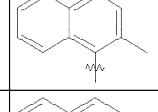
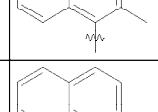
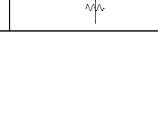
Следующие примеры иллюстрируют неограничивающим образом получение

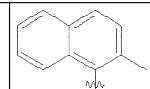
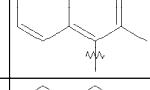
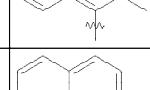
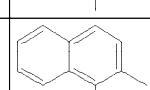
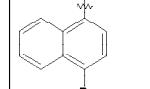
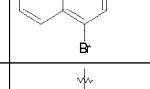
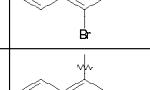
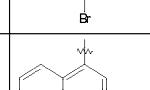
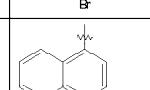
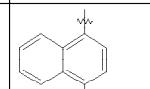
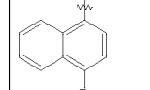
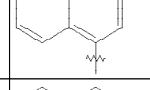
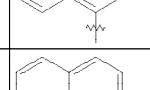
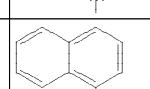
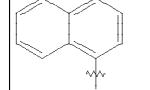
10 соединений формулы (I) по настоящему изобретению.

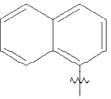
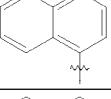
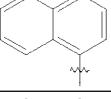
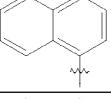
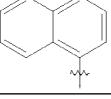
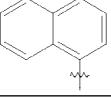
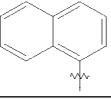
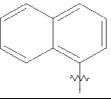
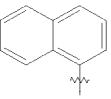
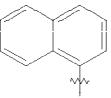
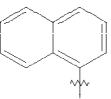
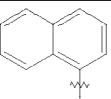
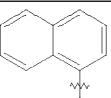
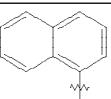
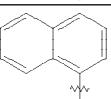
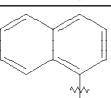
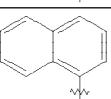
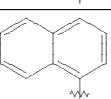


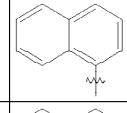
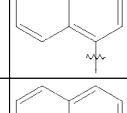
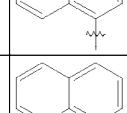
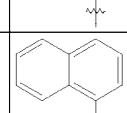
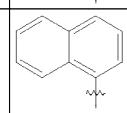
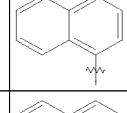
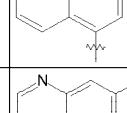
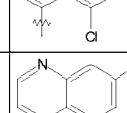
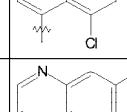
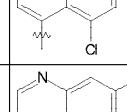
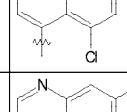
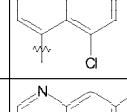
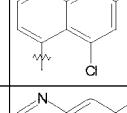
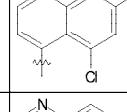
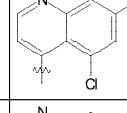
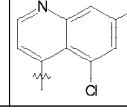
Пр. №	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
1	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
2	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
3	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			354
4	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
5	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356
6	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			370
7	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
8	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			350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

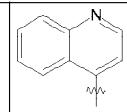
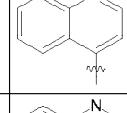
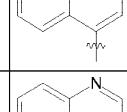
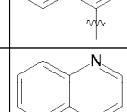
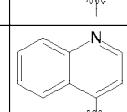
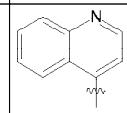
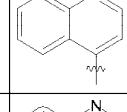
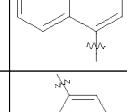
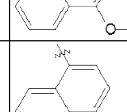
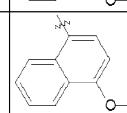
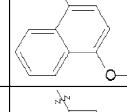
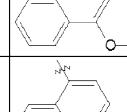
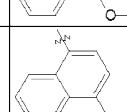
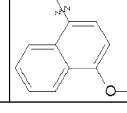
5	15	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			350
10	16	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			366
15	17	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
20	18	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	Me	H			420
25	19	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			334
30	20	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			364
35	21	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			401
40	22	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
45	23	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
50	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

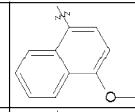
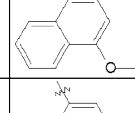
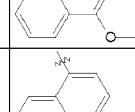
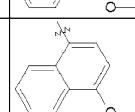
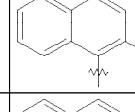
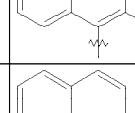
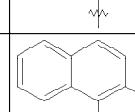
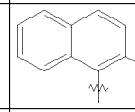
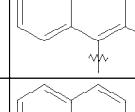
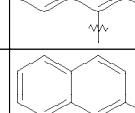
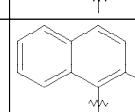
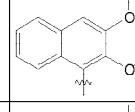
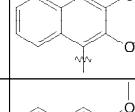
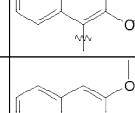
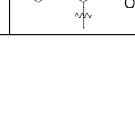
31	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425	
5	32	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			406
10	33	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			383
15	34	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			401
20	35	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			381
25	36	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
30	37	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
35	38	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
40	39	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
45	40	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,25	
50	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

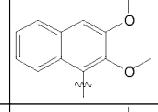
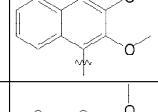
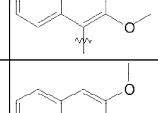
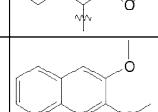
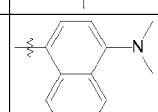
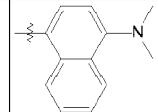
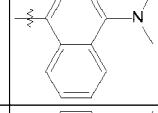
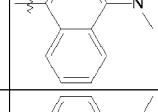
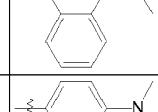
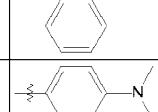
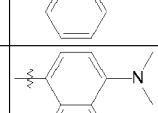
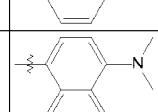
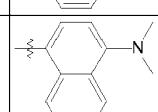
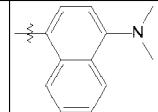
	49	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			387
5	50	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
	51	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
10	52	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	S	H	H			373
	53	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
15	54	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		3,62	
	55	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,69	
20	56	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
	57	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			430
25	58	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			444
	59	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			448
30	60	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		5,2	
	61	A5	N-Me	CF ₃	-	H	O	COOMe	H			432
35	62	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	COOMe	H			431
	63	A5	N-Me	Me	-	F	O	COOMe	H		2,92	
40	64	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
	65	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352

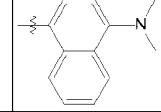
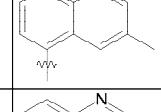
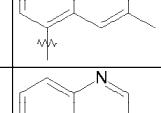
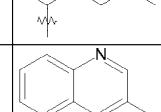
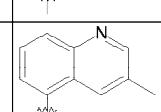
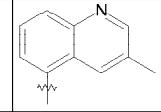
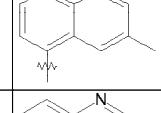
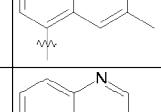
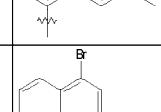
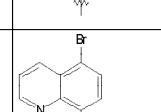
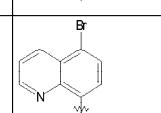
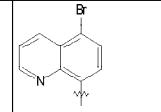
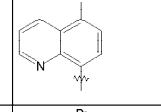
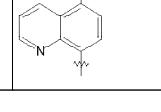
	66	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
5	67	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			366
	68	A5	N-Me	Et	-	F	S	Me	H			382
10	69	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	COOMe	H		3,02	
	70	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356
15	71	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			370
	72	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	S	H	H			372
20	73	A5	N-Me	OMe	-	H	O	COOMe	H			394
	74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
25	75	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,86	
	76	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			319
30	77	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			334
	78	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			336
35	79	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	Me	H			406
	80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
40	81	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
	82	A1	N-Me	H	CHF ₂	H	O	Me	H			369
45	83	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H			366

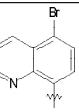
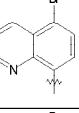
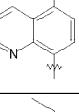
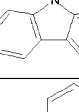
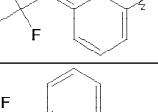
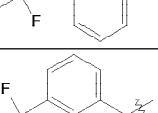
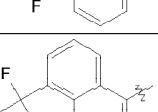
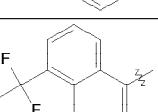
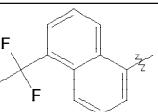
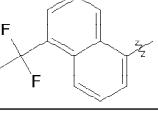
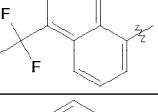
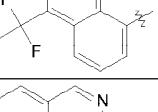
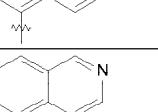
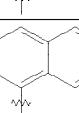
	84	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			320
5	85	A5	N-Me	Et	-	F	O	Et	H			380
	86	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Et	H			384
10	87	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
	88	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
15	89	A5	N-Me	CHF ₂	-	F	O	Me	H			388
	90	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			387
20	91	A5	N-Me	CF ₂ Me	-	H	O	Me	H			384
	92	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			405
25	93	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			374
	94	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			389
30	95	A2	S	Me	H	H	O	H	H			391
	96	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			461
35	97	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
	98	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425
40	99	A1	O	Me	H	H	O	H	H			375
	100	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			442

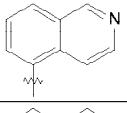
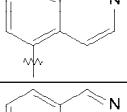
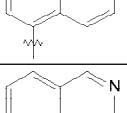
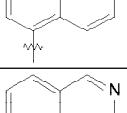
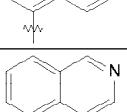
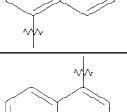
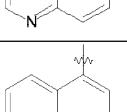
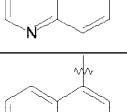
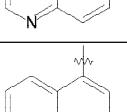
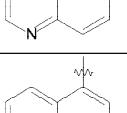
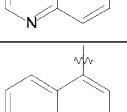
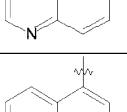
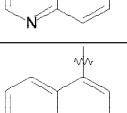
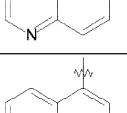
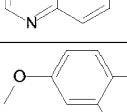
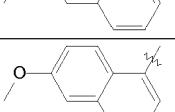
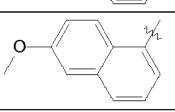
101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
5	102	A2	N-Me	H	H	H	O	H			306
10	103	A1	O	Me	H	Me	O	H			321
15	104	A2	S	Me	H	H	O	H			323
20	105	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H			393
25	106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H			339
30	107	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H			357
35	108	A1	O	Me	H	H	O	H			307
40	109	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H			374
45	110	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H			366
50	111	A2	N-Me	H	H	H	O	H			335
	112	A1	O	Me	H	Me	O	H			350
	113	A2	S	Me	H	H	O	H			352
	114	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H			422
	115	A5	N-Me	Me	-	F	O	H			368
	116	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H			386
	117	A1	O	Me	H	H	O	H			336

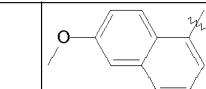
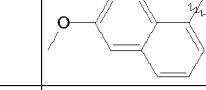
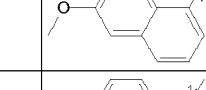
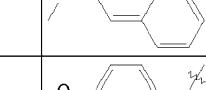
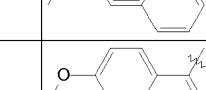
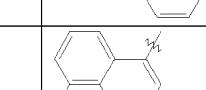
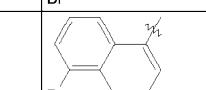
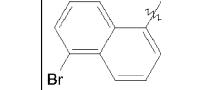
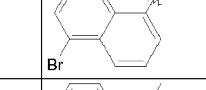
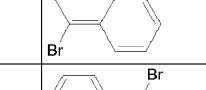
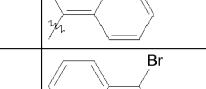
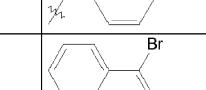
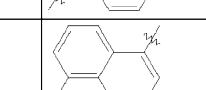
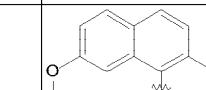
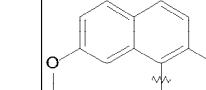
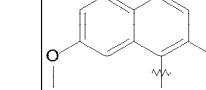
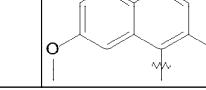
118	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403	
5	119	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			382
10	120	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			396
15	121	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			400
20	122	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			364
25	123	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
30	124	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
35	125	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
40	126	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
45	127	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			422
50	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

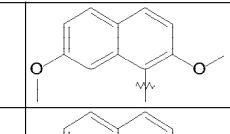
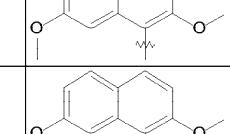
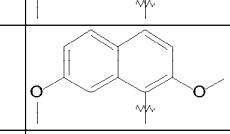
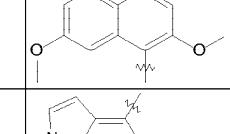
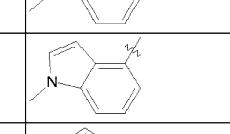
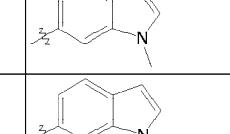
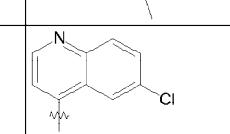
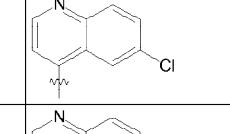
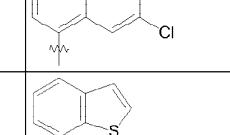
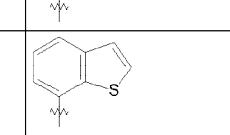
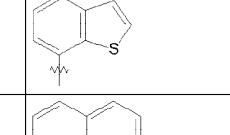
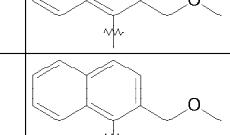
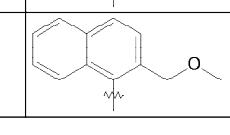
	136	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
5	137	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			398
	138	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
10	139	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
	140	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433
15	141	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			379
	142	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			348
20	143	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			363
	144	A2	S	Me	H	H	O	H	H			365
25	145	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			435
	146	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			381
30	147	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			399
	148	A1	O	Me	H	H	O	H	H			349
35	149	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			416
	150	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			395
40	151	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			409

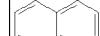
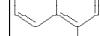
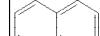
152	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H			413		
5	153	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			351	
10	154	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			320	
15	155	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			335	
20	156	A2	S	Me	H	H	O	H	H			337	
25	157	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			407	
30	158	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			353	
35	159	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			371	
40	160	A1	O	Me	H	H	O	H	H			321	
45	161	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			388	
50	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		

168	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			435
5	169	A1	O	Me	H	H	O	H			385
10	170	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H			452
15	171	A5	N-Me	Me	-	F	O	H			405
20	172	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H			404
25	173	A2	N-Me	H	H	H	O	H			373
30	174	A1	O	Me	H	Me	O	H			388
35	175	A2	S	Me	H	H	O	H			390
40	176	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H			460
45	177	A5	N-Me	Me	-	F	O	H			406
50	178	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H			424
	179	A1	O	Me	H	H	O	H			374
	180	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H			441
	181	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H			337
	182	A2	N-Me	H	H	H	O	H			306
	183	A1	O	Me	H	Me	O	H			321

	184	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
5	185	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
	186	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
10	187	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
	188	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
15	189	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
	190	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
20	191	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
	192	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
25	193	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
	194	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			393
30	195	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
	196	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
35	197	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
	198	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			374
40	199	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
	200	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
45	201	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350

202	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352	
5	203	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			422
10	204	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
15	205	A6	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			386
20	206	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
25	207	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
30	208	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
35	209	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			383
40	210	1	O	Me	H	Me	O	H	H			398
45	211	A2	S	Me	H	H	O	H	H			400
50	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

	221	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			452
5	222	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,96	
	223	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			416
10	224	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
	225	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			433
15	226	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
	227	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			359
20	228	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
	229	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			359
25	230	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			373
	231	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			387
30	232	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			355
	233	A5	N-Me	Me		F	O	H	H			344
35	234	A5	N-Me	Et		F	O	H	H			358
	235	A5	N-Me	CHF2		H	O	H	H			362
40	236	A5	N-Me	Me		F	O	H	H			382
	237	A5	N-Me	Et		F	O	H	H			396
45	238	A5	N-Me	CHF2		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		
	241	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	Me	H		
	242	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H		
	243	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		
	244	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H		
	245	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		
	246	A1	O	Me	H	Me	O	H	H		

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

30 Во флакон Optimizer™ объемом 8 мл взвешивают 1,7 ммоль амина (II). Добавляют 2
мл 1-молярного раствора ацилхлорида (III) (2 ммоля) 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.
35 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™

45 Во флаконы Chemspeed™ объемом 13 мл взвешивают 0,27 ммоль пентасульфида фосфора (P_2S_5). 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 тиоамид анализируют ЖХМС и ЯМР. Недостаточно чистые соединения дополнительно очищают препаративной ЖХМС.

Пример действия А: 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, посевные на субстрате 50/50 торфовая 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.

15 Через 24 часа растения заражают путем разбрзгивания на них водной суспензии спор *Rygeophora 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.

20 В указанных условиях, при дозе 500 ч./мл., хорошая (по меньшей мере 70%) или полная защита наблюдается со следующими соединениями: 1, 2, 3, 6, 8, 9, 11, 12, 25 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 B: *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 корнишона (сорт Vert petit de Paris) в чашках для разведения, посевные 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 разбрзгивания на них водной суспензии спор *Sphaerotheca fuliginea* (100000 спор в мл). Споры собирают с зараженных растений. Зараженные растения корнишона 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./мл. 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, 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 C: *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.

5 Растения пшеницы (сорт Scipion), посевные 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.

10 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
15 при относительной влажности 100% и затем в течение 21-28 дней при относительной
влажности 90%.

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

20 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.

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

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

35 Растения пшеницы (сорт Scipion) в чашках для разведения, посевные 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.

40 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 супензируют 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%.

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

50 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.

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

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

65 Растения редиски (сорт Pernot) в чашках для разведения, посевные 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 корнишона (сорт *Vert petit de Paris*), посевные 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 суспенцируют в питательном растворе, составленном из

20 г/л желатина;
50 г/л D-фруктозы;
2 г/л NH₄NO₃;
1 г/л KH₂PO₄.

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, посевные в субстрат 50/50 торфяная почва-вулканический туф и выращенные при 18-20°C, обрабатывают на стадии семядоли путем разбрзгивания 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-циклогексил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-2,5-диметил-фуран-3-карбоксамид;

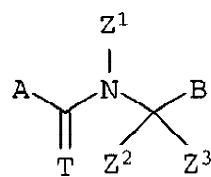
15 N-циклогексил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-5-фтор-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксамид;

N-циклогексил-N-[(3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метилен]-5-фтор-3-(трифторметил)-1-метил-1Н-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

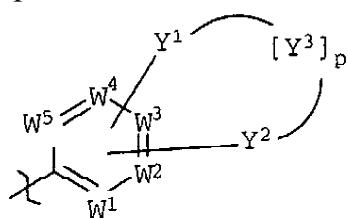
1. Соединение формулы (I)



(I)

где А представляет собой присоединенную через атом углерода, ненасыщенную или частично насыщенную 5-членную гетероциклическую группу, выбранную из 35 тиофенила, фуанила, пиразолила и пирролила, которая может быть замещена от одной до трех R^a группами;

В представляет собой



45 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 50 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;

Z^1 представляет собой незамещенный циклопропил;

Z^2 представляет собой атом водорода, C_1 - C_8 алкил или C_1 - C_8 алкоксикарбонил;

Z^3 независимо представляют собой атом водорода;

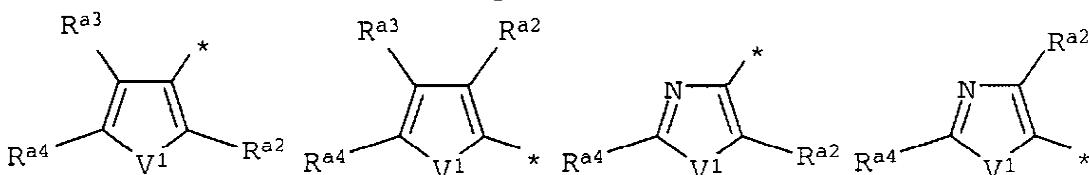
R^a независимо представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; или C_1 - C_8 алкокси;

R^{b1} и R^{b3} независимо представляют собой атом водорода; атом галогена; нитро; C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; ди(C_1 - C_8 алкил)амино; C_1 - C_8 алкокси или C_1 - C_8 алкокси- C_1 - C_8 алкил;

R^{b2} представляет собой C_1 - C_3 алкил;

а также его соли.

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

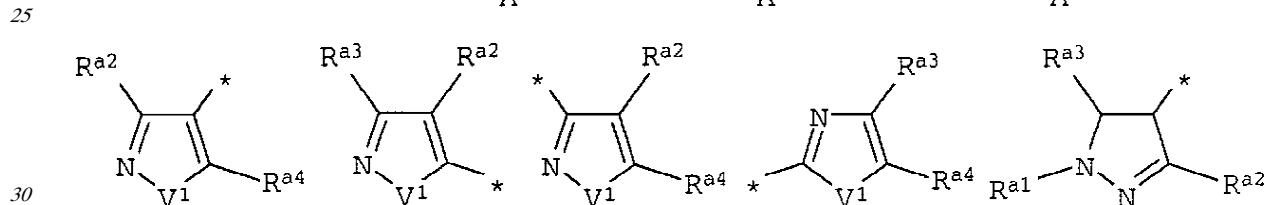


A¹

A²

A³

A⁴



30 где *представляет собой точку присоединения к карбонильному фрагменту;

V^1 представляет собой О, S или NR^{a1} , когда А представляет собой А¹ или А²;

V^1 представляет собой NR^{a1} , когда А представляет собой А³, А⁴, А⁵, А⁶, А⁷, А¹¹ или А¹²;

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

включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

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

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.

3. Соединение по п.п.2, где

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

R^{a2} представляет собой C_1 - C_8 алкил; C_1 - C_8 галогеналкил, 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;

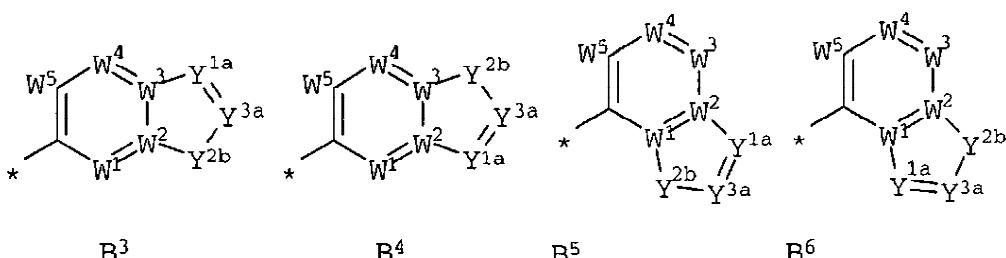
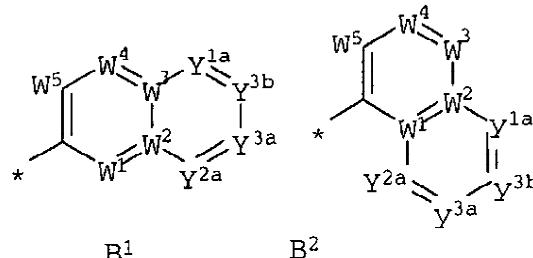
R^{a4} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_8 алкил; C_1 -галогеналкил, включающий до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными.

4. Соединение по п.2 или 3, где

А представляет собой А⁵;

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

5. Соединение по п.1, где В 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

В представляет собой B^1 или B^2 :

W¹-W⁵ независимо представляют собой СВ^{b1}:

V^{1a} , V^{2a} , V^{3a} и V^{3b} независимо представляют собой CP^{b3} , или

В предста вляєт себе як R^5 чи R^6 :

В представляет собой В' или В'',
в1 в5 — это минимум, поэтому в5 въ CR в1

W-W независимо представляют собой CR; χ^1_{la} χ^3_{la} ζ $\chi_{\text{CR}} b^3$

$Y^{(1)}$ и $Y^{(2)}$ независимо пред-
 $\rightarrow^2 b$ $\rightarrow^2 b$

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

Фундаментальная композиция, содержащая в качестве активного ингредиента

8. Фунгицидная композиция, содержащая в качестве активного ингредиента эффективное количество соединения формулы (I) по пп.1-7 и приемлемые с точки зрения сорьского хозяйства подложки, косынки, или календиты.

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.