



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(19) **RU** (11) **2 480 457** (13) **C2**

(51) МПК
C07D 231/16 (2006.01)
C07D 231/12 (2006.01)
C07D 249/04 (2006.01)
C07D 307/68 (2006.01)
C07D 207/34 (2006.01)
A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/707 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2010107171/04, 31.07.2008

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
31.07.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
31.07.2007 EP 07356104.5

(43) Дата публикации заявки: 10.09.2011 Бюл. № 25

(45) Опубликовано: 27.04.2013 Бюл. № 12

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: RU 2003134631 A, 10.05.2005. WO
2006120224 A1, 16.11.2006.

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

(86) Заявка РСТ:
EP 2008/060039 (31.07.2008)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2009/016220 (05.02.2009)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(72) Автор(ы):

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

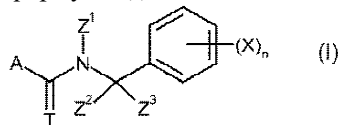
(73) Патентообладатель(и):

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС АГ (DE)

(54) ФУНГИЦИДНЫЕ N-ЦИКЛОАЛКИЛБЕНЗИЛТИОКАРБОКСАМИДЫ ИЛИ N-ЦИКЛОАЛКИЛБЕНЗИЛ-N'-ЗАМЕЩЕННЫЕ АМИДИНОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ

(57) Реферат:

Изобретение относится к N-циклоалкилбензилтиокарбоксамидным или N-циклоалкилбензил-N'-замещенным карбоксимидами производным формулы (I):



в которой А представляет собой карбосвязанную, ненасыщенную 5-членную

гетероциклическую группу, выбранную из пиразолила, пирроллила, триазолила и фуридила, и которая может быть замещена вплоть до четырех заместителей группами R; Т представляет собой S; Z¹ представляет собой незамещенный C₃-C₇-циклоалкил или C₃-C₇-циклоалкил, замещенный вплоть до 2 заместителей, которые могут быть одинаковыми или различными и которые могут быть выбраны из перечня, состоящего из C₁-C₈-алкильных групп; Z² и Z³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода или C₁-C₈-

RU 2 480 457 C2

RU 2 480 457 C2

алкил; X, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₃-C₇-циклоалкил; три(C₁-C₈-алкил)силил; три(C₁-C₈-алкил)силил-C₁-C₈-алкил; бензилокси, фенокси, который может быть замещен вплоть до 2 заместителей группами Q; фенил, который может быть замещен вплоть до 2 заместителей группами Q; или два заместителя X вместе с последующими атомами углерода, к которым они присоединены, образуют метилendioксо; n представляет собой 1, 2 или 3; R, который

может быть одинаковым или различным, представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; Q, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; а также к его сельскохозяйственно приемлемым солям. Изобретение также относится к фунгицидной композиции, содержащей в качестве активного ингредиента эффективное количество соединения формулы (I). Технический результат: получены новые соединения, которые могут найти применение в сельском хозяйстве для борьбы с фитопатогенными грибами сельскохозяйственных культур. 3 н. и 4 з.п. ф-лы, 1 табл., 56 пр.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.

C07D 231/16 (2006.01)
C07D 231/12 (2006.01)
C07D 249/04 (2006.01)
C07D 307/68 (2006.01)
C07D 207/34 (2006.01)
A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/707 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21)(22) Application: 2010107171/04, 31.07.2008

(24) Effective date for property rights:
31.07.2008

Priority:

(30) Convention priority:
31.07.2007 EP 07356104.5

(43) Application published: 10.09.2011 Bull. 25

(45) Date of publication: 27.04.2013 Bull. 12

(85) Commencement of national phase: 01.03.2010

(86) PCT application:
EP 2008/060039 (31.07.2008)(87) PCT publication:
WO 2009/016220 (05.02.2009)

Mail address:

129090, Moskva, ul. B. Spasskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery"

(72) Inventor(s):

DESBORD Philipp (FR),
GARI Stefani (FR),
GROSZhan-KURNUAE Mari-Kler (FR),
ARTMANN Benua (FR),
RINOL'FI Philipp (FR),
VOR Zhan-P'er (FR)

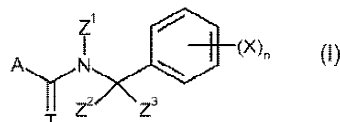
(73) Proprietor(s):

BAJER KROPSAJENS AG (DE)(54) **FUNGICIAL N-CYCLOALKYL BENZYL THIOCARBOXAMIDES OR N-CYCLOALKYL BENZYL-N'-SUBSTITUTED AMIDINE DERIVATIVES**

(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to N-cycloalkylbenzyl thio-carboxamides or N-cycloalkylbenzyl-N'-substituted carboxy-imide amide derivatives of formula (I):



wherein A is a

carbo-bound, unsaturated 5-member heterocyclic group selected from pyrazolyl, pyrrolyl, triazolyl and furanyl, and which can be substituted with up to four substitute groups R; T is S; Z¹ is unsubstituted C₃-C₇-cycloalkyl or C₃-C₇-cycloalkyl, substituted with up to 2 substitutes which can be identical or different and which can be selected from a list consisting of C₁-C₈-alkyl groups; Z² and Z³, which

can be identical or different, are a hydrogen atom or C₁-C₈-alkyl; X, which can be identical or different, is a halogen atom; C₁-C₈-alkyl; C₁-C₈-halogenalkyl, containing up to 3 halogen atoms which can be identical or different; C₁-C₈-halogenalkoxy, containing up to 3 halogen atoms which can be identical or different; C₃-C₇-cycloalkyl; tri(C₁-C₈-alkyl)silyl; tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl; benzyloxy, phenoxy, which can be substituted with up to 2 substitute groups Q; phenyl, which can be substituted with up to 2 substitute groups Q; or two substitutes X together with the next carbon atoms to which they are bonded form methylene dioxo; n is 1, 2 or 3; R, which can be identical or different, is a hydrogen atom; a halogen atom; C₁-C₈-alkyl; C₁-C₈-halogenalkyl, containing up to 3 halogen atoms which can be identical or different; Q, which can be identical or different, is a halogen atom; as well as

agriculturally acceptable salts thereof. The invention also relates to a fungicidal composition containing an effective amount of the compound of formula (I) as an active ingredient.

EFFECT: novel compounds which can be used in agriculture for plant pathogenic fungi control are obtained.

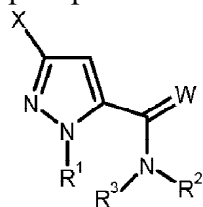
7 cl, 1 tbl, 56 ex

R U 2 4 8 0 4 5 7 C 2

R U 2 4 8 0 4 5 7 C 2

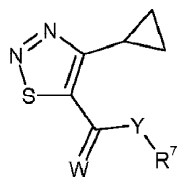
Данное изобретение относится к N-циклоалкилбензилтиокарбоксамидным или N-циклоалкилбензил-N'-замещенным карбоксиимидамидным производным, способу их получения, их применению в качестве активных фунгицидов, в частности в форме фунгицидных композиций, и к способам борьбы с фитопатогенными грибами, особенно с фитопатогенными грибами растений, с применением данных соединений или композиций.

В международной патентной заявке WO-96/38419 некоторые 2-пиридилметилтиокарбоксамидные производные в общем включены в расширенное раскрытие многочисленных соединений следующей формулы:



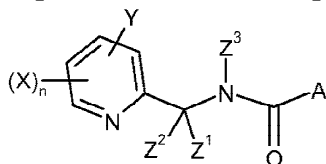
в которой X представляет собой галоген, W может представлять собой атом серы, R¹ может представлять собой C₁-C₄-алкил, R² может представлять собой C₃-C₇-циклоалкил и R³ может представлять собой разные заместители среди фенила. Однако данный документ конкретно не раскрывает, а также не предлагает выделить такие соединения, в которых атом азота тиокарбоксамидного остатка может быть замещен циклоалкилом.

В международной патентной заявке WO-06/098128 некоторые 2-пиридилметилтиокарбоксамидные производные в общем включены в расширенное раскрытие многочисленных соединений следующей формулы:



в которой W может представлять собой атом серы, Y может представлять собой N-циклоалкил и R⁷ может представлять собой разные заместители среди фенила. Однако данный документ конкретно не раскрывает, а также не предлагает выделить такие соединения, в которых атом азота тиокарбоксамидного остатка может быть замещен циклоалкилом.

Международная патентная заявка WO-06/120224 раскрывает 2-пиридилметилтиокарбоксамидные производные следующей формулы:

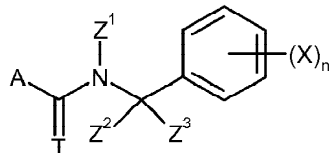


с отсутствием в данном документе намека на то, чтобы приготовить фунгицидные N-бензил(тиокарбоксамидные или карбоксиимидамидные) производные согласно изобретению.

Всегда существует повышенный интерес в сельском хозяйстве к применению новых пестицидных соединений, чтобы избежать или контролировать создание устойчивых штаммов к активным ингредиентам. Также существует повышенный интерес к применению новых соединений, являющихся более активными, чем уже известные соединения, с целью снижения количеств активного соединения, предназначенного для

использования, в то же время поддерживающих эффективность, по меньшей мере, эквивалентную эффективности уже известных соединений. Авторы настоящей работы выявили новое семейство соединений, которые обладают вышеназванными эффектами или преимуществами.

В соответствии с этим, данное изобретение относится к N-циклоалкилбензилтиокарбоксамидным или N-циклоалкилбензил-N'-замещенным карбоксимидамидным производным формулы (I):



(I)

в которой

- A представляет собой карбосвязанную, ненасыщенную или частично насыщенную, 5-членную гетероциклическую группу, которая может быть замещена вплоть до четырех заместителей группами R;

- T представляет собой S, N-R^a, N-OR^a, N-NR^aR^b или N-CN;

- Z¹ представляет собой незамещенный C₃-C₇-циклоалкил или C₃-C₇-циклоалкил, замещенный вплоть до 10 заместителей атомами или группами, которые могут быть одинаковыми или различными и которые могут быть выбраны из перечня, состоящего из атомов галогена; циано; C₁-C₈-алкила; C₁-C₈-галогеналкила, содержащего вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащего вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкоксикарбонила; C₁-C₈-галогеналкоксикарбонила, содержащего вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкиламинокарбонила; ди-C₁-C₈-алкиламинокарбонила;

- Z² и Z³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; C₁-C₈-алкил; C₂-C₈-алкенил; C₂-C₈-алкинил; циано; нитро; атом галогена; C₁-C₈-алкокси; C₂-C₈-алкенилокси; C₂-C₈-алкинилокси; C₃-C₇-циклоалкил; C₁-C₈-алкилсульфенил; амино; C₁-C₈-алкиламино; ди-C₁-C₈-алкиламино; C₁-C₈-алкоксикарбонил; C₁-C₈-алкилкарбамоил; ди-C₁-C₈-алкилкарбамоил; N-C₁-C₈-алкил-C₁-C₈-алкоксикарбамоил; или

- Z² и Z³ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, могут образовать замещенный или незамещенный C₃-C₇-циклоалкил;

- X, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; нитро; циано; гидроксил; сульфанил; амино; пентафтор-λ6-сульфанил; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкиламино; ди-C₁-C₈-алкиламино; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-алкилсульфанил; C₁-C₈-галогеналкилсульфанил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкенил; C₂-C₈-галогеналкенил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкинил; C₂-C₈-галогеналкинил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-

C_8 -алкенилокси; C_2 - C_8 -галогеналкенилокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_2 - C_8 -алкинилокси; C_2 - C_8 -галогеналкинилокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_3 - C_7 -циклоалкил; C_3 - C_7 -циклоалкил- C_1 - C_8 -алкил; C_3 - C_7 -галогенциклоалкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; формил; формилокси; формиламино; карбоксы; карбамоил; N-гидроксикарбамоил; карбамат; (гидроксиимино)- C_1 - C_8 -алкил; C_1 - C_8 -алкилкарбонил; C_1 - C_8 -галогеналкилкарбонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкилкарбамоил; ди- C_1 - C_8 -алкилкарбамоил; N- C_1 - C_8 -алкилоксикарбамоил; C_1 - C_8 -алкоксикарбамоил; N- C_1 - C_8 -алкил- C_1 - C_8 -алкоксикарбамоил; C_1 - C_8 -алкоксикарбонил; C_1 - C_8 -галогеналкоксикарбонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкиламинокарбонил; ди- C_1 - C_8 -алкиламинокарбонил; C_1 - C_8 -алкилкарбонилокси; C_1 - C_8 -галогеналкилкарбонилокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкилкарбониламино; C_1 - C_8 -галогеналкилкарбониламино, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкиламинокарбонилокси; ди- C_1 - C_8 -алкиламинокарбонилокси; C_1 - C_8 -алкилоксикарбонилокси; C_1 - C_8 -алкилсульфенил; C_1 - C_8 -галогеналкилсульфенил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкилсульфинил; C_1 - C_8 -галогеналкилсульфинил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкилсульфонил; C_1 - C_8 -галогеналкилсульфонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C_1 - C_8 -алкоксиимино; (C_1 - C_8 -алкоксиимино)- C_1 - C_8 -алкил; (C_1 - C_8 -алкенилоксиимино)- C_1 - C_8 -алкил; (C_1 - C_8 -алкинилоксиимино)- C_1 - C_8 -алкил; (бензилоксиимино)- C_1 - C_8 -алкил; три(C_1 - C_8 -алкил)силил; три(C_1 - C_8 -алкил)силил- C_1 - C_8 -алкил; бензилокси, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; бензилсульфанил, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; бензиламино, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; нафтил, который может быть замещен вплоть до 6 заместителей группами Q; фенокси, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; фениламино, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; фенилсульфанил, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; фенилметилен, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; фенил, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; пиридинил, который может быть замещен вплоть до 4 заместителей группами Q; пиридинилокси, который может быть замещен вплоть до 4 заместителей группами Q;

• два заместителя X вместе с последующими атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовать 5- или 6-членный, насыщенный, карбо- или гетероцикл, который может быть замещен вплоть до четырех заместителей группами Q, которые могут быть одинаковыми или различными;

• n представляет собой 1, 2, 3, 4 или 5;

• R, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом водорода; атом галогена; циано; нитро; amino; сульфанил; пентафтор-λ-6-сульфанил; C_1 - C_8 -алкиламино; ди- C_1 - C_8 -алкиламино; три(C_1 - C_8 -алкил)силил; C_1 - C_8 -алкилсульфанил; C_1 - C_8 -галогеналкилсульфанил, содержащий вплоть до 9 атомов

галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкенил; C₂-C₈-галогеналкенил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкинил; C₂-C₈-галогеналкинил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкенилокси; C₂-C₈-алкинилокси; C₃-C₇-циклоалкил; C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-алкилсульфинил; C₁-C₈-алкилсульфонил; C₁-C₈-алкоксиимино; (C₁-C₈-алкоксиимино)-C₁-C₈-алкил; (бензилоксиимино)-C₁-C₈-алкил; фенокси; бензилокси; бензилсульфанил; бензиламино; нафтил; галогенфенокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкилкарбонил; C₁-C₈-галогеналкилкарбонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкоксикарбонил; C₁-C₈-галогеналкоксикарбонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкиламинокарбонил; ди-C₁-C₈-алкиламинокарбонил;

• R^a и R^b, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси-C₁-C₈-алкил; C₂-C₈-алкенил; C₂-C₈-галогеналкенил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₂-C₈-алкинил; C₂-C₈-галогеналкинил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₃-C₇-циклоалкил; C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₈-алкил; C₃-C₇-галогенциклоалкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; формил; C₁-C₈-алкилкарбонил; C₁-C₈-галогеналкилкарбонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкилсульфонил; C₁-C₈-галогеналкилсульфонил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; фенил, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; нафтил, который может быть замещен вплоть до 6 заместителей группами Q; фенилметилен, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q; фенилсульфонил, который может быть замещен вплоть до 5 заместителей группами Q;

• Q, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; циано; нитро; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-алкилсульфанил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; три(C₁-C₈)алкилсилил и три(C₁-C₈)алкилсилил-C₁-C₈-алкил;

а также к их солям, N-оксидам, комплексам с металлами, комплексам с металлоидами и необязательно оптически активным или геометрическим изомерам.

Любое из соединений согласно данному изобретению может существовать в одной или нескольких оптических или хиральных изомерных формах в зависимости от числа асимметрических центров данного соединения. Данное изобретение, таким образом, относится в равной степени ко всем оптическим изомерам и их рацемическим или

скалемическим смесям (термин “скалемический” обозначает смесь энантиомеров в разных пропорциях) и к смесям из всех возможных стереоизомеров во всех пропорциях. Диастереоизомеры и/или оптические изомеры могут быть выделены методами, которые известны в чистом виде обычному специалисту в данной области.

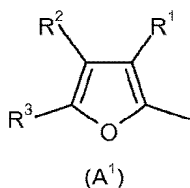
Любое из соединений согласно данному изобретению может существовать в одной или нескольких геометрических изомерных формах в зависимости от числа двойных связей в данном соединении. Данное изобретение, таким образом, относится в равной степени ко всем геометрическим изомерам и ко всем возможным смесям во всех пропорциях. Геометрические изомеры могут быть выделены обычными методами, которые известны в чистом виде обычному специалисту в данной области.

Для соединений согласно данному изобретению использованы большей частью следующие общие термины со следующими значениями:

- галоген означает один из фтора, брома, хлора или йода;
- гетероатом может представлять собой азот, кислород или серу;
- любая алкильная группа, алкенильная группа или алкинильная группа может быть прямой или разветвленной;
- в случае аминогруппы или аминофрагмента любой другой аминоксодержащей группы, замещенной двумя заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, данные два заместителя вместе с азотом, к которому они присоединены, могут образовать гетероциклическую группу, предпочтительно 5-7-членную гетероциклическую группу, которая может быть замещенной и может содержать другие гетероатомы, например, морфолино или пиперидинил.

Предпочтительные соединения согласно данному изобретению представляют собой соединения формулы (I), где А выбран в перечне, состоящем из

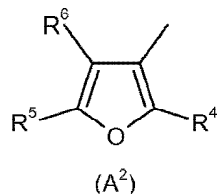
- гетероцикла формулы (A¹)



в которой

R¹ до R³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A²)

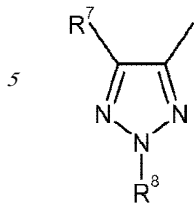


в которой

R⁴ до R⁶, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена,

которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A³)



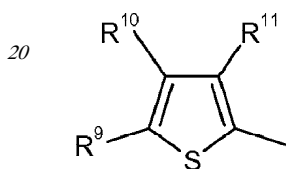
10 (A³)

в которой

R⁷ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий

15 вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; R⁸ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

- гетероцикла формулы (A⁴)

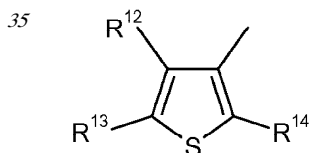


25 (A⁴)

в которой

R⁹ до R¹¹, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; amino; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкилсульфанил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или

35 - гетероцикла формулы (A⁵)



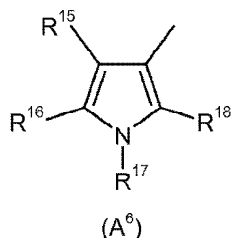
(A⁵)

в которой

R¹² и R¹³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-алкокси; amino; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R¹⁴ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-алкокси; amino; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A⁶)



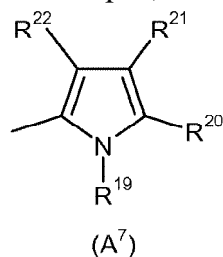
в которой

10 R¹⁵ представляет собой атом водорода; атом галогена; циано; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

15 R¹⁶ и R¹⁸, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкоксикарбонил; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

20 R¹⁷ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

- гетероцикла формулы (A⁷)

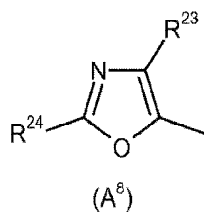


30 в которой

R¹⁹ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

35 R²⁰ до R²², которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A⁸)

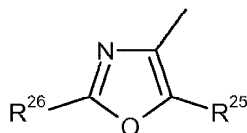


в которой

45 R²³ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

50 R²⁴ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A⁹)



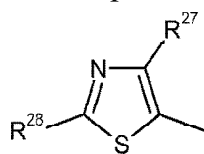
5 (A⁹)

в которой

R²⁵ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть
10 одинаковыми или различными;

R²⁶ представляет собой атом водорода; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или
различными;

15 - гетероцикла формулы (A¹⁰)



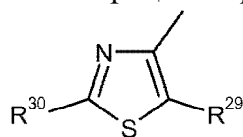
20 (A¹⁰)

в которой

R²⁷ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть
25 одинаковыми или различными;

R²⁸ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть
одинаковыми или различными; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9
30 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; amino; C₁-C₅-алкиламино или ди(C₁-C₅-алкил)амино;

- гетероцикла формулы (A¹¹)



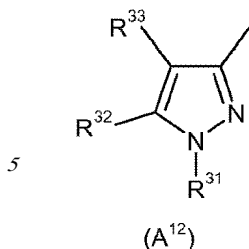
35 (A¹¹)

в которой

R²⁹ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть
одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9
40 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R³⁰ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть
одинаковыми или различными; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9
45 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; amino; C₁-C₅-алкиламино или ди(C₁-C₅-алкил)амино;

50 - гетероцикла формулы (A¹²)



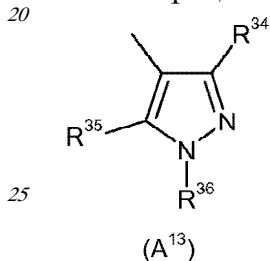
в которой

10 R³¹ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

R³² представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

15 R³³ представляет собой атом водорода; атом галогена; нитро; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A¹³)



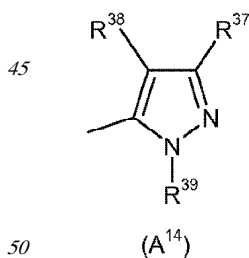
в которой

30 R³⁴ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₃-C₅-циклоалкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкинилокси или C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

35 R³⁵ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; циано; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкилсульфанил, C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; amino; C₁-C₅-алкиламино или ди(C₁-C₅-алкил)амино;

40 R³⁶ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

- гетероцикла формулы (A¹⁴)

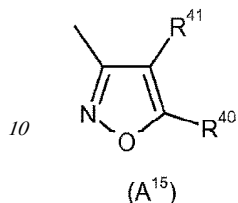


в которой

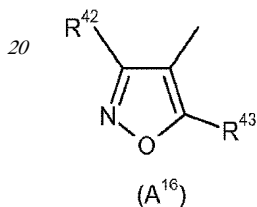
R³⁷ и R³⁸, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой

атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси или C₁-C₅-алкилсульфанил;

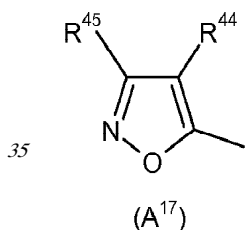
5 R³⁹ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;
- гетероцикла формулы (A¹⁵)



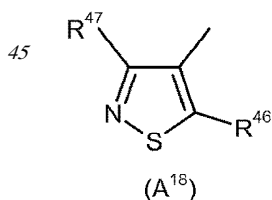
15 в которой
R⁴⁰ и R⁴¹, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;
- гетероцикла формулы (A¹⁶)



25 в которой
R⁴² и R⁴³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или амино;
30 - гетероцикла формулы (A¹⁷)



40 в которой
R⁴⁴ и R⁴⁵, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;
- гетероцикла формулы (A¹⁸)



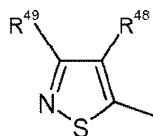
50 в которой
R⁴⁷ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть

одинаковыми или различными;

R^{46} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1-C_5 -алкил; C_1-C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть

одинаковыми или различными, или C_1-C_5 -алкилсульфанил;

- гетероцикла формулы (A^{19})

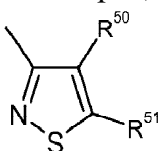


(A^{19})

в которой

R^{49} и R^{48} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1-C_5 -алкил; C_1-C_5 -алкокси; C_1-C_5 -галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C_1-C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A^{20})

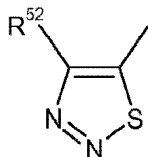


(A^{20})

в которой

R^{50} и R^{51} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1-C_5 -алкил; C_1-C_5 -алкокси; C_1-C_5 -галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными, или C_1-C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A^{21})

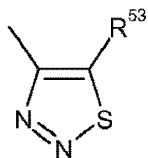


(A^{21})

в которой

R^{52} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1-C_5 -алкил или C_1-C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A^{22})



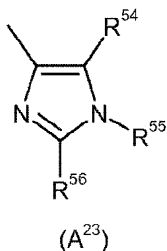
(A^{22})

в которой

R^{53} представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть

одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A^{23})

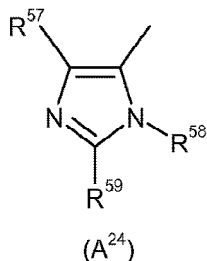


в которой

R^{54} и R^{56} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{55} представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

- гетероцикла формулы (A^{24})

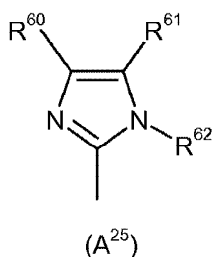


в которой

R^{57} и R^{59} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{58} представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

- гетероцикла формулы (A^{25})

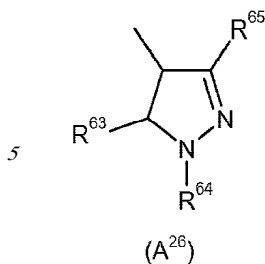


в которой

R^{60} и R^{61} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{62} представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

- гетероцикла формулы (A^{26})



10 в которой

R⁶⁵ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₃-C₅-циклоалкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-алкокси; C₂-C₅-алкинилокси или C₁-C₅-галогеналкоксокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть

15 одинаковыми или различными;

R⁶³ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; циано; C₁-C₅-алкокси; C₁-C₅-алкилсульфанил, C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₅-галогеналкоксокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или

20 различными; амино; C₁-C₅-алкиламино или ди(C₁-C₅-алкил)амино;

R⁶⁴ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил.

Более предпочтительные соединения согласно данному изобретению представляют собой соединения формулы (I), где А выбран в перечне, состоящем из А²; А⁶; А¹⁰ и А¹³, описанных в данном документе.

25

Другие предпочтительные соединения формулы (I) согласно данному изобретению представляют собой соединения, где Т означает серу.

Другие предпочтительные соединения согласно данному изобретению представляют собой соединения формулы (I), где Z¹ означает C₃-C₇-циклоалкил, замещенный вплоть до 10 группами или атомами, которые могут быть одинаковыми или различными и которые могут быть выбраны в перечне, состоящем из атомов галогена; C₁-C₈-алкила; C₁-C₈-галогеналкила, содержащего вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси или C₁-C₈-галогеналкоксокси, содержащего вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть

30 одинаковыми или различными; предпочтительнее Z¹ означает незамещенный C₃-C₇-циклоалкил; еще предпочтительнее Z¹ означает циклопропил.

Другие предпочтительные соединения согласно данному изобретению представляют собой соединения формулы (I), где Х, который может быть одинаковым или различным, означает атом галогена; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; три(C₁-C₈-алкил)силл; C₁-C₈-алкокси или C₁-C₈-галогеналкоксокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или

35 различными.

Другие более предпочтительные соединения согласно данному изобретению представляют собой соединения формулы (I), где два последующие заместителя Х вместе с фенильным кольцом образуют замещенный или незамещенный 1,3-бензодиоксолил; 1,2,3,4-тетрагидрохиноксалинил; 3,4-дигидро-2Н-1,4-бензоксазинил; 1,4-бензодиоксанил; инданил; 2,3-дигидробензофуранил; индолинил.

40

Другие предпочтительные соединения согласно данному изобретению

45

представляют собой соединения формулы (I), где R, который может быть одинаковым или различным, означает атом водорода; атом галогена; циано; C₁-C₈-алкиламино; ди-
 5 C₁-C₈-алкиламино; три(C₁-C₈-алкил)силил; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкокси; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 9 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-алкилсульфанил; амино; гидроксил; нитро; C₁-C₈-алкоксикарбонил; C₂-C₈-алкинилокси.

Вышеупомянутые предпочтения в отношении заместителей соединений согласно
 10 данному изобретению могут быть объединены разными способами. Данные комбинации предпочтительных признаков, таким образом, обеспечивают подклассы соединений согласно изобретению. Примерами таких подклассов предпочтительных соединений согласно изобретению могут быть сочетания:

15 - предпочтительных признаков А с предпочтительными признаками Т, Z¹, Z², Z³, Х, n, R и Q;

- предпочтительных признаков Т с предпочтительными признаками А, Z¹, Z², Z³, Х, n, R и Q;

20 - предпочтительных признаков Z¹ с предпочтительными признаками А, Т, Z², Z³, Х, n, R и Q;

- предпочтительных признаков Z² с предпочтительными признаками А, Т, Z¹, Z³, Х, n, R и Q;

25 - предпочтительных признаков Z³ с предпочтительными признаками А, Т, Z¹, Z², Х, n, R и Q;

- предпочтительных признаков Х с предпочтительными признаками А, Т, Z¹, Z², Z³, n, R и Q;

30 - предпочтительных признаков n с предпочтительными признаками Т, Z¹, Z², Z³, Х, R и Q;

- предпочтительных признаков R с предпочтительными признаками А, Т, Z¹, Z², Z³, Х, n и Q;

35 - предпочтительных признаков Q с предпочтительными признаками А, Т, Z¹, Z², Z³, Х, n и R.

В данных комбинациях предпочтительных признаков заместителей соединений согласно данному изобретению, указанные предпочтительные признаки могут быть также выбраны среди более предпочтительных признаков каждого из А, Т, Z¹, Z², Z³,
 40 Х, n, R и Q, чтобы образовать самые предпочтительные подклассы соединений согласно изобретению.

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

Таким образом, в следующем аспекте данного изобретения предлагается способ P1 для получения соединения формулы (I), в которой Т представляет собой S, как
 45 показано следующей схемой реакции:



Способ P1

где А, Z¹-Z³, X и n принимают значения, определенные в настоящем описании.

Способ Р1 может быть осуществлен в присутствии осерняющего средства.

Амидные производные формулы (II) известны или могут быть приготовлены известными способами, например, как описано в европейской патентной заявке
5 EP-06/356008.

Подходящие осерняющие реагенты для осуществления способа Р1 согласно данному изобретению могут представлять собой серу (S), сероводородную кислоту (H₂S), сульфид натрия (Na₂S), гидросульфид натрия (NaHS), трисульфид бора (B₂S₃),
10 бис(диэтилалюминий)сульфид ((AlEt₂)₂S), сульфид аммония ((NH₄)₂S), пентасульфид фосфора (P₂S₅), реагент Лавессона/Lawesson's (2,4-бис(4-метоксифенил)-1,2,3,4-дитадифосфетан 2,4-дисульфид) или осерняющий реагент с полимерной подложкой, такой как описанный в *J. Chem. Soc. Perkin 1, (2001), 358*,

15 в присутствии или в отсутствие каталитического или стехиометрического или более количества основания, такого как неорганическое или органическое основание.

Предпочтение отдается применению карбонатов щелочных металлов, таких как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия; гетероциклические ароматические основания, такие как пиридин, пиколин, лутидин,
20 коллидин; и также третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диметиламинопиридин или N-метилпиперидин.

Подходящие растворители для осуществления способа Р1 согласно данному изобретению могут представлять собой обычные инертные органические
25 растворители. Предпочтение отдается применению необязательно галогенированных алифатических, алициклических или ароматических углеводородов, таких как петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ,
30 тетрахлорид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простых эфиров, таких как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, метил-трет-бутиловый эфир, метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан или 1,2-диэтоксиэтан; нитрилов, таких как ацетонитрил, пропионитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; сернистых растворителей, таких как сульфолан или дисульфид углерода.

35 При выполнении способа Р1 согласно данному изобретению температуры реакции могут изменяться в пределах относительно широкого интервала. В общем, данные способы выполнены при температурах от 0°C до 160°C, предпочтительно от 10°C до 120°C. Метод контроля температуры для способов согласно данному изобретению
40 представляет собой применение микроволновой технологии.

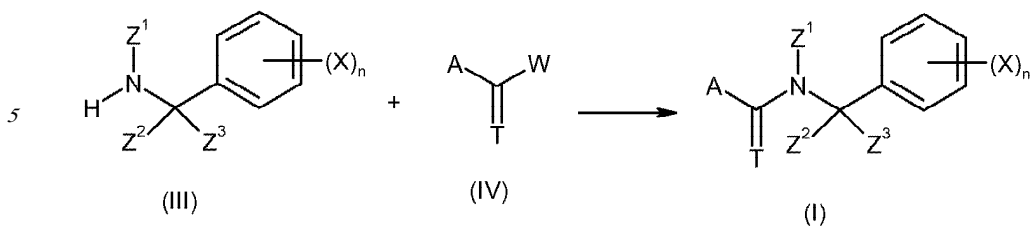
Способ Р1 согласно данному изобретению обычно выполняется при атмосферном давлении. Можно также работать при повышенном или пониженном давлении.

При выполнении способа Р1 согласно данному изобретению могут быть
45 использованы 1 моль или избыток серного эквивалента осерняющего реагента и от 1 до 3 молей основания на моль амидного производного формулы (II).

Также можно использовать компоненты реакции в других соотношениях. Обработку проводят известными методами. Обычно реакцию смесь концентрируют при пониженном давлении. Остаток, который получается, может быть
50 очищен известными методами, такими как хроматография или перекристаллизация, от любых примесей, которые все же могут присутствовать.

Согласно следующему аспекту данного изобретения предлагается способ Р2 для получения соединения формулы (I), в которой Т выбран в списке, состоящем из N-R^a,

N-OR^a, N-NR^aR^b или N-CN, как показано следующей схемой реакции:



Способ P2

10 где

- A, Z¹-Z³, W¹ до W⁵ и В принимают значения, определенные в настоящем описании;
- U² представляет собой атом хлора или метилсульфанильную группу.

15 В способе P2 согласно изобретению стадию 2 можно выполнять в присутствии кислотосвязывающего вещества и в присутствии растворителя.

20 N-циклоалкиламиновые производные формулы (III) известны или могут быть приготовлены известными способами, такими как восстановительное аминирование альдегида или кетона (Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 2006, p 2014, синтез соединений 7 и 8), или восстановлением иминов (Tetrahedron, 2005, p 11689), или нуклеофильным замещением галогена, мезилата или тозилата (Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887, получение промежуточного продукта для соединения 28).

25 N-замещенный карбоксиимидоилхлорид формулы (IV) известен или может быть приготовлен 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.

30 N-замещенный или N,N-дизамещенный гидразоноилхлорид формулы (IV) известны или могут быть приготовлены известными способами, например, как описано в Tetrahedron, 1991, 47, p 447 и Journal of Geterocyclic Chemistry, 1983, 20, p 225.

35 N-цианокарбоксиимидоилхлорид формулы (IV) известен или может быть приготовлен известными способами, например, как описано в Tetrahedron Letters, 1968, p 5523 и Bioorganic and Medicinal Chemistry, 2006, p 4723.

40 Подходящие кислотосвязывающие вещества для выполнения способа P2 согласно данному изобретению могут представлять собой неорганические и органические основания, которые являются обычными для таких реакций. Предпочтение отдается применению гидроксидов щелочноземельных металлов или щелочных металлов, таких как гидроксид натрия, гидроксид кальция, гидроксид калия или другие производные гидроксида аммония; карбонатов щелочных металлов, таких как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия; ацетатов щелочных металлов или щелочноземельных металлов, таких как ацетат натрия, ацетат калия, ацетат кальция; гидридов щелочноземельных металлов или щелочных металлов, таких как гидрид натрия или гидрид калия; алколюлятов щелочноземельных металлов или щелочных металлов, таких как метилат натрия, этилат натрия, пропилат натрия или трет-бутилат калия; и также третичных аминов, таких как триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинопиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN) или диазабициклоундецен (DBU); или акцептору кислоты с полимерной подложкой

45 (например, детализированный в <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

50

Возможно также работать в отсутствие любого дополнительного вещества, связывающего кислоту.

Подходящие растворители для осуществления способа P2 согласно данному

изобретению могут представлять собой обычные инертные органические растворители. Предпочтение отдается применению необязательно галогенированных алифатических, алициклических или ароматических углеводородов, таких как петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простых эфиров, таких как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, метил-трет-бутиловый эфир, метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан или 1,2-диэтоксиэтан; нитрилов, таких как ацетонитрил, пропионитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; амидов, таких как N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон или гексаметилтриамид фосфорной кислоты; сложных эфиров, таких как метилацетат или этилацетат; сульфоксидов, таких как диметилсульфоксид; или сульфононов, таких как сульфолан.

При выполнении способа P2 согласно данному изобретению температуры реакции могут изменяться в пределах относительно широкого интервала. В общем, данные способы выполнены при температурах от 0°C до 160°C, предпочтительно от 10°C до 120°C. Метод контроля температуры для способов согласно данному изобретению представляет собой применение микроволновой технологии.

Способ P2 согласно данному изобретению обычно выполняется при атмосферном давлении. Можно также работать при повышенном или пониженном давлении.

При выполнении способа P2 согласно данному изобретению аминное производное формулы (III) может быть использовано в виде его соли, такой как хлоргидрат или любая другая подходящая соль.

При выполнении способа P2 согласно данному изобретению могут быть использованы 1 моль или избыток аминного производного формулы (II) и от 1 до 3 молей кислотосвязывающего вещества на моль N-замещенного карбоксимидоилхлорида формулы (IV).

Также можно использовать компоненты реакции в других соотношениях. Обработку проводят известными методами.

Обычно реакционную смесь концентрируют при пониженном давлении. Остаток, который получается, может быть очищен известными методами, такими как хроматография или перекристаллизация, от любых примесей, которые все же могут присутствовать.

Соединения формулы (I) согласно данному изобретению могут быть приготовлены в соответствии со способами, представленными в настоящем описании. Хотя будет понятно, что на основе общих знаний и доступных публикаций специалист будет способен адаптировать данные способы согласно особенностям каждого из соединений, которое требуется синтезировать.

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

Выражение “эффективное и нефитотоксичное количество” означает количество композиции согласно изобретению, которое является достаточным, чтобы контролировать или разрушать грибки, присутствующие или с вероятностью появления на культурах, и которое не вызывает какой-либо значительный симптом фитотоксичности на указанных культурах. Такое количество может изменяться в пределах широкого интервала в зависимости от грибка, предназначенного для контроля, типа культуры, климатических условий и соединений, включенных в

фунгицидную композицию согласно изобретению. Данное количество может быть определено систематическими полевыми испытаниями, которые находятся в рамках способностей специалиста в данной области.

5 Таким образом, согласно данному изобретению предлагается фунгицидная композиция, содержащая в качестве активного ингредиента эффективное количество соединения формулы (I), определенной в настоящем описании, сельскохозяйственно приемлемую подложку, носитель или наполнитель.

10 Согласно данному изобретению термин “подложка” обозначает природное или синтетическое, органическое или неорганическое соединение, с которым объединено или связано активное соединение формулы (I), чтобы сделать его более удобным для применения, особенно на части растения. Таким образом, данная подложка обычно является инертной и должна быть сельскохозяйственно приемлемой. Данная подложка может представлять собой твердое вещество или жидкость. Примеры 15 подходящих подложек включают глины, природные или синтетические силикаты, кремнезем, полимеры, воски, твердые удобрения, воду, спирты, в частности, бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла и их производные. Также могут быть использованы смеси таких подложек.

20 Композиция согласно изобретению может также содержать дополнительные компоненты. В частности, композиция еще может содержать ПАВ. ПАВ может представлять собой эмульгатор, диспергатор или смачивающий агент ионного или неионного типа или смесь таких ПАВ. Можно назвать, например, соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой 25 или нафталинсульфоновой кислоты, поликонденсаты этиленоксида с жирными спиртами или с жирными кислотами или с жирными аминами, замещенные фенолы (в частности, алкилфенолы или арилфенолы), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, тауриновые производные (в частности, алкилтаураты), фосфорные сложные эфиры полиоксиэтилированных спиртов или фенолов, жирно-кислотные сложные эфиры полиолов, и производные вышеуказанных соединений, содержащих 30 сульфатные, сульфонатные и фосфатные функции. Присутствие, по меньшей мере, одного ПАВ обычно важно, когда активное соединение и/или инертная подложка нерастворимы в воде и когда направляющее средство для применения представляет собой воду. Предпочтительно, содержание ПАВ может составлять от 5 до 40 мас.% композиции.

40 Необязательно могут быть включены дополнительные компоненты, например, защитные коллоиды, адгезивы, загустители, тиксотропные средства, вещества для проникновения, стабилизаторы, пассиваторы. Более типично, активные соединения могут быть объединены с любой твердой или жидкой добавкой, что выполняется по обычным методикам приготовления препаратов.

Обычно композиция согласно данному изобретению может содержать от 0,05 до 99 мас.% активного соединения, предпочтительно, от 10 до 70 мас.%.

45 Соединения согласно данному изобретению могут быть использованы в разных формах, таких как аэрозольный диспенсер, капсулированная суспензия, концентрат для холодного туманообразования, порошок для опыливания, эмульгирующий концентрат, эмульсия масло-в-воде, эмульсия вода-в-масле, инкапсулированная 50 гранула, мелкодисперсная гранула, текучий концентрат для обработки зерна, газ (под давлением), генерирующий газ продукт, гранула, концентрат для горячего туманообразования, макрогранула, микрогранула, диспергируемый в масле порошок, смешиваемый с маслом текучий концентрат, смешиваемая с маслом жидкость, паста,

5 фитопалочка, порошок для сухой обработки семян, покрытие с пестицидом для зерна, растворимый концентрат, растворимый порошок, раствор для обработки семян, суспензионный концентрат (текущий концентрат), жидкость для применения методом ультрамалообъемного опрыскивания (УМО/ULV), суспензия для применения методом ультрамалообъемного опрыскивания (УМО/ULV), вододиспергируемые гранулы или таблетки, вододиспергируемый порошок для обработки суспензией, водорастворимые гранулы или таблетки, водорастворимый порошок для обработки зерна и смачивающийся порошок. Данные композиции включают не только композиции, 10 которые готовы к применению для растения или зерна, предназначенных для обработки с помощью подходящего приема, такого как опрыскивание или распыление, но также концентрированные коммерческие композиции, которые должны быть разбавлены перед применением на сельскохозяйственной культуре.

15 Соединения согласно данному изобретению могут быть также смешаны с одним или несколькими веществами с активностью инсектицида, фунгицида, бактерицида, аттрактанта, акарицида или феромона или другими соединениями с биологической активностью. Полученные таким образом смеси обычно имеют расширенный спектр активности. Смеси с другими фунгицидными соединениями особенно полезны.

20 Примеры подходящих фунгицидных компонентов для смешивания могут быть выбраны из следующих перечислений:

(1) ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот, например, беналаксил, беналаксил-М, бупиримат, клотилакон, диметиримол, этиримол, фуралаксил, гимексазол, металаксил, металаксил-М, офурас, оксадиксил и оксалиновая кислота;

25 (2) ингибиторы митоза и клеточного деления, например, беномил, карбендазим, хлорфеназол, диэтофенкарб, этабоксам, фуберидазол, пенцикурон, тиабендазол, тиофанат, тиофанат-метил и зоксамид;

30 (3) ингибиторы респирации, например, дифлуметорим как ингибитор СI-респирации; биксафен, боскалид, карбоксин, фенфурам, флутоланил, флуопирам, фураметпир, фурмециклокс, изопиразам (9R-компонент), изопиразам (9S-компонент), мепронил, оксикарбоксин, пентиопирад, тифлузамид как ингибитор СII-респирации; амисулбром, азоксистробин, циазофамид, димоксистробин, энестробурин, фамоксадон, фенамидон, флуоксастробин, крезоксим-метил, метоминостробин, оризастробин, пикоксистробин, пиракlostробин, пирибенкарб, трифлуксистробин как ингибитор СIII-респирации;

(4) соединения, способные действовать в качестве разобщителя, как, например, бинапакрил, динокап, флуазинам и мептилдинокап;

40 (5) ингибиторы образования АТФ(АТР), например, фентин ацетат, фентин хлорид, фентин гидроксид и силтиофам;

(6) ингибиторы биосинтеза аминокислот и/или белков, например, андоприм, бластицидин-С, ципродинил, касугамицин, касугамицин гидрохлорид гидрат, мепанипирим и пириметанил;

45 (7) ингибиторы сигнальной трансдукции, например, фенпиклонил, флудиоксонил и хиноксифен;

50 (8) ингибиторы липидного и мембранного синтеза, например, бифенил, хлостолинат, эдифенфос, этридазол, йодокарб, ипробенфос, ипродион, изопротиолан, процимидон, пропамокарб, пропамокарб гидрохлорид, пиразофос, толклофос-метил и винклозолин;

(9) ингибиторы биосинтеза эргостерола, например, альдиморф, азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, диклобутразол, дифеноконазол, диниконазол, диниконазол-М, додеморф, додеморф ацетат, эпоксиконазол,

этаконазол, фенаримол, фенбуконазол, фенгексамид, фенпропидин, фенпропиморф, флухинконазол, флурпримидол, флузилазол, флутриафол, фурконазол, фурконазол-цис, гексаконазол, имазалил, имазалил сульфат, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, нафтифин, нуаримол, окспоконазол, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пипералин, прохлораз, пропиконазол, протиоконазол, пирибутикарб, пирифенокс, хинконазол, симеконазол, спироксамин, тебуконазол, тербинафин, тетраконазол, триадимефон, триадименол, тридеморф, трифлумизол, трифорин, тритиконазол, униконазол, виниконазол и вориконазол;

(10) ингибиторы синтеза клеточных стенок, например, бентиаваликарб, диметоморф, флуморф, ипроваликарб, мандипропамид, полиоксины, полиоксорим, протиокарб, валидамицин А и валифенал;

(11) ингибиторы биосинтеза меланина, например, карпропамид, диклоцимет, феноксанил, фталид, пирохилон и трициклазол;

(12) соединения, способные стимулировать защитные силы хозяина, как, например, ацибензолар-S-метил, пробеназол и тиадинил;

(13) соединения, способные проявлять многосайтовое действие, как, например, бордоская смесь, каптафол, каптан, хлороталонил, нафтенат меди, оксид меди, оксихлорид меди, препараты меди, такие как гидроксид меди, сульфат меди, дихлофлуанид, дитианон, додин, додин свободное основание, фербам, флуорофолпет, фолпет, гуазатин, гуазатин ацетат, иминоктадин, иминоктадин альбесилат, иминоктадин триацетат, манкоппер, манкозеп, манеб, метирам, метирам цинк, оксинкоппер, пропамидин, пропинеб, сера или препараты серы, включающие полисульфид кальция, тирам, толилфлуанид, зинеб и зирам;

(14) следующие соединения как, например, 2,3-дибутил-6-хлортиено[2,3-d]пиримидин-4(3H)-он, этил (2Z)-3-амино-2-циано-3-фенилпроп-2-еноат, N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1,3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-{2-[1,1'-би(циклопропил)-2-ил]фенил}-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2E)-2-(2-[[6-(3-хлор-2-метилфенокси)-5-фторпиримидин-4-ил]окси]фенил)-2-(метоксиимино)-N-метилэтанамид, (2E)-2-{2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-дихлорфенил)бут-3-ен-2-илиден]амино]окси]метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилэтанамид, 2-хлор-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)пиридин-3-карбоксамид, N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-(формиламино)-2-гидроксибензамид, 5-метокси-2-метил-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]амино]окси]метил]фенил)-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-он, (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]амино]окси]метил]фенил)этанамид, (2E)-2-(метоксиимино)-N-метил-2-{2-[(E)-{1-[3-(трифторметил)фенил]этокси}имино]метил]фенил}этанамид, (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-фтор-2-фенилэтинил]окси]фенил]этилиден]амино]окси]метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилэтанамид, 1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)циклогептанол, метил 1-(2,2-диметил-2,3-дигидро-1H-инден-1-ил)-1H-имидазол-5-карбоксилат, N-этил-N-метил-N'-{2-метил-5-(трифторметил)-4-[3-(триметилсилил)пропокси]фенил}имидоформаид, N'-{5-(дифторметил)-2-метил-4-[3-(триметилсилил)пропокси]фенил}-N-этил-N-метилимидоформаид, O-{1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропил}1H-имидазол-1-карботиоат, N-[2-(4-{3-(4-хлорфенил)проп-2-ин-1-ил]окси}-3-метоксифенил)этил]-N2-(метилсульфонил)валинамид, 5-хлор-7-(4-метилпиперидин-1-ил)-6-(2,4,6-трифторфенил)[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин, 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиол, пропамокарб-фосэтил, 1-[(4-метоксифенокси)метил]-2,2-диметилпропил 1H-имидазол-1-карбоксилат, 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-бутоксифен-6-йод-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-карбоксамид, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[2-(1,1,2,3,3,3-гексафторпропокси)фенил]-1Н-пиразол-4-карбоксамид, 3,4,5-трихлорпиридин-2,6-дикарбонитрил, 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметилизоксазолидин-3-ил]пиридин, 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-6-метилпиридазин, 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторфенил)-3,6-диметилпиридазин, хинолин-8-ол, хинолин-8-ол сульфат (2:1) (соль), бентиазол, бетоксазин, капсимицин, карвон, хинометионат, хлоронеб, цуфранеб, цифлуфенамид, цимоксанил, ципросульфамид, дазомет, дебакарб, дихлорофен, дикломезин, диклоран, дифензокват, дифензокват метилсульфат, дифениламин, экомат, феримзон, флуметовер, флуопиколоид, флуороимид, флусульфамид, фосэтил-алюминий, фосэтил-кальций, фосэтил-натрий, гексахлорбензол, ирумамицин, изотианил, метасульфокарб, метил (2E)-2-{2-[(циклопропил[(4-метоксифенил)имино]метил}тио)метил]фенил}-3-метоксиакрилат, метилизотиоцианат, метрафенон, (5-бром-2-метокси-4-метилпиридин-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, 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-йодпиридин-3-карбоксамид, N-{(Z)-[(циклопропилметокси)имино]}[6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил}-2-фенилацетамид, N-{(E)-[(циклопропилметокси)имино]}[6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил}-2-фенилацетамид, натамицин, диметилдитиокарбамаат никеля, нитротал-изопропил, октилинон, оксамокарб, оксифентиин, пентахлорфенол и соли, феназин-1-карбоновая кислота, фенотрин, фосфористая кислота и ее соли, пропамокарб фосэтилат, пропанозин-натрий, прохиназид, пирролнитрин, квинтоцен, S-проп-2-ен-1-ил 5-амино-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-3-оксо-2,3-дигидро-1Н-пиразол-1-карботиоат, теклофталам, текназен, триазоксид, трихламид, 5-хлор-N'-фенил-N'-проп-2-ин-1-илтиофен-2-сульфоногидразид и зариламид.

Композиция согласно изобретению, содержащая смесь соединения формулы (I) с бактерицидным соединением, может быть также особенно полезной. Примеры подходящих бактерицидных компонентов для смешивания могут быть выбраны в следующем списке: бронопол, дихлорофен, нитрапирин, диметилдитиокарбамаат никеля, касугамицин, октилинон, фуранкарбоновая кислота, окситетрациклин, пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сульфат меди и другие препараты меди.

Соединения формулы (I) и фунгицидная композиция согласно изобретению могут применяться для целей лечения или в качестве превентивной меры для борьбы с фитопатогенными грибами растений или сельскохозяйственных культур. Таким образом, согласно следующему аспекту изобретения предлагается способ борьбы в лечебных или превентивных целях с фитопатогенными грибами растений или сельскохозяйственных культур, отличающийся тем, что соединение формулы (I) и фунгицидную композицию согласно изобретению применяют для семян, растения или плода растения или для почвы, на которой растение произрастает или на которой требуется его выращивать.

Способ обработки согласно данному изобретению может быть также применим, чтобы обработать посадочный материал для размножения, такой как клубни или

корневища, но также и семена, всходы или высаживаемую рассаду и растения или высаживаемые растительные саженцы. Этот способ обработки может также применяться для обработки корней. Способ обработки согласно изобретению может также применяться для обработки надземных частей растения, таких как стволы, стебли или черенки, листья, цветки и плоды растения, представляющего интерес.

В числе растений, которые могут быть защищены способом согласно данному изобретению, могут быть названы хлопчатник, лен, виноградная лоза, плодовые и овощные культуры, такие как Rosaceae sp. (например, односеменные плодовые, такие как яблони и груши, а также косточковые плодовые растения, такие как абрикосовые, миндальные и персиковые деревья), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (например, банановые деревья и овощные бананы), Rubiaceae sp., Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфрут); Solanaceae sp. (например, томаты), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (например, салаты), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp., Papilionaceae sp. (например, горохи), Rosaceae sp. (например, виды земляники); основные сельскохозяйственные культуры, такие как Graminae sp. (например, кукуруза, газонные травы или зерновые злаки, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень и тритикале), Asteraceae sp. (например, подсолнечник), Cruciferae sp. (например, рапс), Fabaceae sp. (например, земляные орехи), Papilionaceae sp. (например, соя), Solanaceae sp. (например, виды картофеля), Chenopodiaceae sp. (например, виды свеклы), Elaeis sp. (например, масличная пальма); садовые и лесные культуры; а также генетически модифицированные гомологи данных культур.

В числе болезней растений или сельскохозяйственных культур, которые можно контролировать способом согласно данному изобретению, могут быть названы

- мучнисто-росяные болезни, такие как

болезни от видов блюмерия (*Blumeria*), вызванные, например, *Blumeria graminis*;
болезни от видов подосфера (*Podospaera*), вызванные, например, *Podospaera leucotricha*;

болезни от видов сферотека (*Sphaerotheca*), вызванные, например, *Sphaerotheca fuliginea*;

болезни от видов унцинула (*Uncinula*), вызванные, например, *Uncinula necator*;

- ржавчинные болезни, такие как

болезни от видов гимноспорангиум (*Gymnosporangium*), вызванные, например, *Gymnosporangium sabinae*;

болезни от видов хемилейя (*Hemileia*), вызванные, например, *Hemileia vastatrix*;

болезни от видов факопсора (*Phakopsora*), вызванные, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomiae*;

болезни от видов пукциния (*Puccinia*), вызванные, например, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* или *Puccinia striiformis*;

болезни от видов уромисес (*Uromyces*), вызванные, например, *Uromyces appendiculatus*;

- болезни от оомицетов, такие как

белые ржавчины от грибов альбуго (*Albugo*), вызванные, например, *Albugo candida*;
ложные мучнисто-росяные болезни от видов *Bremia*, вызванные, например, *Bremia lactucae*;

пероноспорозы от видов пероноспора (*Peronospora*), вызванные, например, *Peronospora pisi* и *Peronospora brassicae*;

фитофторозы от видов фитофтора(*Phytophthora*), вызванные, например, *Phytophthora infestans*;

ложные мучнисто-росяные болезни от видов плазмопара(*Plasmopara*), вызванные, например, *Plasmopara viticola*;

пероноспорозы от видов псевдопероноспора(*Pseudoperonospora*), вызванные, например, *Pseudoperonospora humuli* и *Pseudoperonospora cubensis*;

питиозные болезни от видов питиум(*Pythium*), вызванные, например, *Pythium ultimum*;

• аскохитозы, пятнистости и болезни увядания листьев, такие как альтернариозы от видов альтернария(*Alternaria*), вызванные, например, *Alternaria solani*;

церкоспорозы от видов церкоспора(*Cercospora*), вызванные, например, *Cercospora beticola*;

кладоспориозы от видов кладоспориум(*Cladosporium*), вызванные, например, *Cladosporium cucumerinum*;

болезни от видов кохлиоболус(*Cochliobolus*), вызванные, например, *Cochliobolus sativus* (*Conidiaform: Drechslera, Syn: Helminthosporium*) или *Cochliobolus miyabeanus*;

болезни от видов коллетотрихум(*Colletotrichum*), вызванные, например, *Colletotrichum lindemuthianum*;

болезни от видов циклокониум(*Cycloconium*), вызванные, например, *Cycloconium oleaginum*;

болезни от видов диапорте(*Diaporthe*), вызванные, например, *Diaporthe citri*;

болезни от видов эльсинео(*Elsinoe*), вызванные, например, *Elsinoe fawcettii*;

болезни от видов глоспориум(*Gloesporium*), вызванные, например, *Gloesporium laeticolor*;

болезни от видов гломерелла(*Glomerella*), вызванные, например, *Glomerella cingulata*;

болезни от видов гиньярдия(*Guignardia*), вызванные, например, *Guignardia bidwellii*;

болезни от видов лептосферия(*Leptosphaeria*), вызванные, например, *Leptosphaeria maculans* и *Leptosphaeria nodorum*;

болезни от видов магнапортэ(*Magnaporthe*), вызванные, например, *Magnaporthe grisea*;

микосфереллезы от видов микосферелла(*Mycosphaerella*), вызванные, например, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* и *Mycosphaerella fijiensis*;

пятнистости феосфереллезные от видов феосферия(*Phaeosphaeria*), вызванные, например, *Phaeosphaeria nodorum*;

пятнистости гельминтоспориозные от видов пиренофора(*Pyrenophora*), вызванные, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora tritici repentis*;

рамуляриозы от видов рамулярия(*Ramularia*), вызванные, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*;

ринхоспориозы от видов ринхоспориум(*Rhynchosporium*), вызванные, например, *Rhynchosporium secalis*;

септориозы от видов септория(*Septoria*), вызванные, например, *Septoria apii* и *Septoria lycopersici*;

тифулезы от видов тифула(*Typhula*), вызванные, например, *Typhula incarnata*;

паршевые болезни от видов вентурия(*Venturia*), вызванные, например, *Venturia inaequalis*;

• болезни корней, влагалищ листа и стеблей, такие как

- болезни от видов кортициум(*Corticium*), вызванные, например, *Corticium graminearum*;
- фузариозы от видов фузариум(*Fusarium*), вызванные, например, *Fusarium oxysporum*;
- офиоболезы от видов геуманномицес(*Gaeumannomyces*), вызванные, например, *Gaeumannomyces graminis*;
- ризоктониозы от видов ризоктония(*Rhizoctonia*), вызванные, например, *Rhizoctonia solani*;
- болезни от видов сарокладиум(*Sarocladium*), вызванные, например, *Sarocladium oryzae*;
- болезни от видов склеротиум(*Sclerotium*), вызванные, например, *Sclerotium oryzae*;
- болезни от видов тапезия(*Tapesia*), вызванные, например, *Tapesia acuformis*;
- корневые гнили от видов тиелавиопсис(*Thielaviopsis*), вызванные, например, *Thielaviopsis basicola*;
- болезни колоса и метелки, включая сердцевину кукурузного початка, такие как альтернариозы от видов альтернария(*Alternaria*), вызванные, например, *Alternaria spp.*;
- гнили аспергиллезные от видов аспергиллус(*Aspergillus*), вызванные, например, *Aspergillus flavus*;
- кладоспориозы от видов кладоспориум(*Cladosporium*), вызванные, например, *Cladosporium cladosporioides*;
- спорыньевые болезни от видов клавицепс(*Claviceps*), вызванные, например, *Claviceps purpurea*;
- фузариозы от видов фузариум(*Fusarium*), вызванные, например, *Fusarium culmorum*;
- гиббереллезы от видов гибберелла(*Gibberella*), вызванные, например, *Gibberella zeae*;
- болезни от видов монографелла(*Monographella*), вызванные, например, *Monographella nivalis*;
- головневые и твердые головневые болезни, такие как пыльные головневые болезни от видов сфацелотека (*Sphacelotheca*), вызванные, например, *Sphacelotheca reiliana*;
 - твердые головневые болезни от видов тиллеция(*Tilletia*), вызванные, например, *Tilletia caries*;
- головневые болезни от видов уроцистис(*Urocystis*), вызванные, например, *Urocystis occulta*;
- пыльные головневые болезни от видов устиляго(*Ustilago*), вызванные, например, *Ustilago nuda*;
- гнили плодов и болезни с образованием плесени, такие как гнили аспергиллезные от видов аспергиллус(*Aspergillus*), вызванные, например, *Aspergillus flavus*;
 - гнили от видов *Botrytis*, вызванные, например, *Botrytis cinerea*;
 - плесени от видов пенициллиум(*Penicillium*), вызванные, например, *Penicillium expansum* и *Penicillium purpurogenum*;
 - гнили от видов ризопус(*Rhizopus*), вызванные, например, *Rhizopus stolonifer*;
 - склеротиниозы от видов склеротиния(*Sclerotinia*), вызванные, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;
- вертициллезы от видов вертициллиум(*Verticillium*), вызванные, например, *Verticillium alboatrum*;
- разложения, плесени, увядания, гнили и полегания, передающиеся через семена и почву

альтернариозы от видов альтернария(*Alternaria*), вызванные, например, *Alternaria brassicicola*;

гнили афаномицетные от видов афаномицес(*Aphanomyces*), вызванные, например, *Aphanomyces euteiches*;

5 аскохитозы от видов аскохита(*Ascochyta*), вызванные, например, *Ascochyta lentis*;

гнили аспергиллезные от видов аспергиллус(*Aspergillus*), вызванные, например, *Aspergillus flavus*;

10 кладоспориозы от видов кладоспориум(*Cladosporium*), вызванные, например, *Cladosporium herbarum*;

болезни от видов кохлиоболус(*Cochliobolus*), вызванные, например, *Cochliobolus sativus*; (*Conidiaform: Drechslera, Bipolaris Syn: Helminthosporium*);

болезни от видов коллетотрихум(*Colletotrichum*), вызванные, например, *Colletotrichum coccodes*;

15 фузариозные гнили корней от видов фузариум(*Fusarium*), вызванные, например, *Fusarium culmorum*;

болезни от видов гиберелла(*Giberella*), вызванные, например, *Giberella zeae*;

20 гнили корней от видов макрофомина(*Macrophomina*), вызванные, например, *Macrophomina phaseolina*;

болезни от видов микродохиум(*Microdochium*), вызванные, например, *Microdochium nivale*;

болезни от видов монографелла(*Monographella*), вызванные, например, *Monographella nivalis*;

25 плесени пенициллиновые от видов пенициллиум(*Penicillium*), вызванные, например, *Penicillium expansum*;

фомозы от видов фома(*Phoma*), вызванные, например, *Phoma lingam*;

болезни от видов фомопсис(*Phomopsis*), вызванные, например, *Phomopsis sojae*;

30 фитофторозные гнили корней от видов фитофтора(*Phytophthora*), вызванные, например, *Phytophthora cactorum*;

пятнистости гельминтоспориозные от видов пиренофора(*Pyrenophora*), вызванные, например, *Pyrenophora graminea*;

35 пирикулярнозы от видов пирикулярия(*Pyricularia*), вызванные, например, *Pyricularia oryzae*;

питиозные болезни от видов питиум(*Pythium*), вызванные, например, *Pythium ultimum*;

40 ризоктониозы от видов ризоктония(*Rhizoctonia*), вызванные, например, *Rhizoctonia solani*;

болезни от видов ризопус(*Rhizopus*), вызванные, например, *Rhizopus oryzae*;

гнили склероциальные от видов склеротиум(*Sclerotium*), вызванные, например, *Sclerotium rolfsii*;

45 болезни от видов септория(*Septoria*), вызванные, например, *Septoria nodorum*;

тифулезы от видов тифула(*Typhula*), вызванные, например, *Typhula incarnata*;

вертициллезы от видов вертициллиум(*Verticillium*), вызванные, например, *Verticillium dahliae*;

- раковые болезни, метельчатости и некрозы, такие как

50 болезни от видов нектрия(*Nectria*), вызванные, например, *Nectria galligena*;

- ожоги, такие как

молиниозы от видов моилиния(*Monilinia*), вызванные, например, *Monilinia laxa*;

- курчавости листьев или скручивания листьев, включая деформацию цветков и

плода, такие как

экзобазидиозы от видов экзобазидиум(*Exobasidium*), вызванные, например, *Exobasidium vexans*;

болезни от видов тафрина(*Taphrina*), вызванные, например, *Taphrina deformans*;

• болезни с отмиранием частей дерева, такие как

эска-болезни, вызванные, например, *Phaeomoniella clamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*;

болезни от видов ганодерма(*Ganoderma*), вызванные, например, *Ganoderma boninense*;

• болезни цветков и семян, такие как

гнили от видов ботритис(*Botrytis*), вызванные, например, *Botrytis cinerea*;

• болезни клубней, такие как

ризоктониозы от видов ризоктония(*Rhizoctonia*), вызванные, например, *Rhizoctonia solani*;

гельминтоспориозы от видов гельминтоспориум(*Helminthosporium*), вызванные, например, *Helminthosporium solani*;

• ложные мучнисто-росяные болезни (виды килы), такие как

болезни от видов плазмодиофора(*Plasmodiophora*), вызванные, например,

Plasmodiophora brassicae;

• болезни, вызванные бактериальными организмами, такими как

виды ксантомонас (*Xanthomonas*), например, *Xanthomonas campestris pv. oryzae*;

виды псевдомонас(*Pseudomonas*), например, *Pseudomonas syringae pv. lachrymans*;

виды эрвиния (*Erwinia*), например, *Erwinia amylovora*.

Фунгицидная композиция согласно данному изобретению также может быть использована против грибных болезней, способных возникать на или внутри лесоматериала. Термин “лесоматериал” означает все типы видов древесины и все типы обработки данной древесины, предназначенной для строительства, например, твердую древесину, древесину высокой плотности, ламинированную древесину и фанеру.

Способ для обработки древесины согласно данному изобретению в основном состоит в контактировании одного или нескольких соединений согласно изобретению или композиции согласно изобретению; это включает, например, непосредственное применение, опрыскивание, погружение, инъекцию или любые другие подходящие способы.

Доза активного соединения, обычно применяемая по способу обработки согласно данному изобретению, составляет в основном и преимущественно от 10 до 800 г/га, предпочтительно от 50 до 300 г/га для применений при лиственной обработке.

Применяемая доза активного вещества составляет в основном и преимущественно от 2 до 200 г на 100 кг зерна, предпочтительно от 3 до 150 г на 100 кг зерна в случае обработки зерна.

Очевидно понятно, что указанные в настоящем описании дозы даны в качестве иллюстративных примеров способа согласно данному изобретению. Специалист в данной области будет знать, как адаптировать дозы применения, а именно, согласно природе растения или культуры, предназначенных для обработки.

Фунгицидная композиция согласно данному изобретению также может быть использована для обработки генетически модифицированных организмов соединениями в соответствии с изобретением или агрохимическими композициями в соответствии с изобретением. Генетически модифицированные растения представляют собой растения, в геноме которых стабильно интегрирован чужеродный ген, кодирующий белок, представляющий интерес. Выражение “чужеродный ген,

кодирующий белок, представляющий интерес”, по существу, означает гены, которые придают трансформированному растению новые агрономические свойства или гены для улучшения агрономического качества модифицированного растения.

5 Соединения или смеси согласно изобретению могут быть также использованы для приготовления композиции, применимой с лечебной или профилактической целью для лечения грибковых заболеваний человека или животного, таких как микозы, дерматозы, трихофитозы или заболевания, вызываемые *Aspergillus spp.*, например, *Aspergillus fumigatus*.

10 Различные аспекты изобретения ниже будут проиллюстрированы ссылкой к последующей таблице образцов соединений и последующему приготовлению или эффективности образцов. Нижеследующая таблица иллюстрирует неограничивающим образом примеры соединений согласно изобретению. В следующей таблице М+Н (или М-Н) означает пик молекулярного иона, плюс или минус 1 а.м.у. (единица атомной массы), соответственно, наблюдаемый в масс-спектрокопии, и М (АрсI+) означает пик молекулярного иона, который находили посредством положительной химической ионизации при атмосферном давлении в масс-спектрокопии.

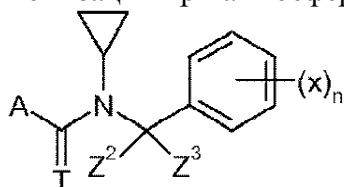


Таблица 1

25

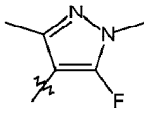
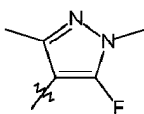
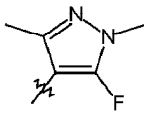
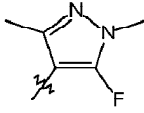
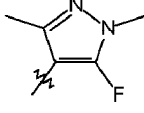
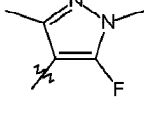
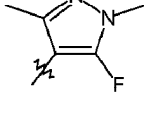
30

35

40

45

50

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
5 1		S	cPr	H	H	4-(4-Cl-фенокси)	430	4,59
10 2		S	cPr	H	H	2-F-4-(3-Cl-4-F-фенил)	450	4,73
15 3		S	cPr	H	H	2-Cl-3-CF ₃	406	3,92
20 4		S	cPr	H	H	2,6-Et ₂	360	4,39
25 5		S	cPr	H	H	4-OPh	396	4,06
30 6		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃	406	4,42
35 7		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	376	4,64

40

45

50

5

10

15

20

25

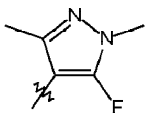
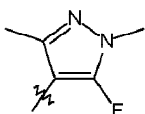
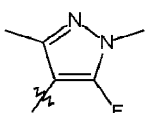
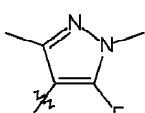
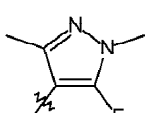
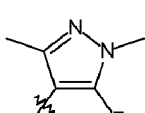
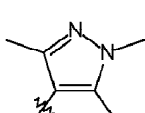
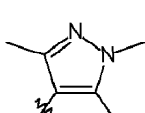
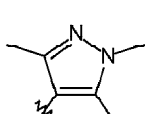
30

35

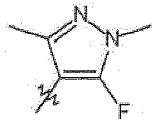
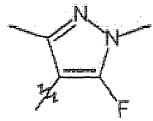
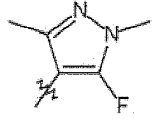
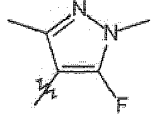
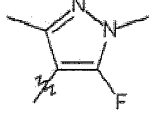
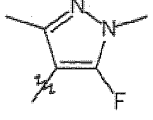
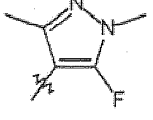
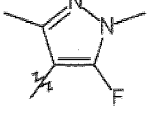
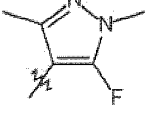
40

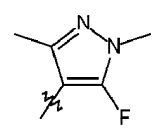
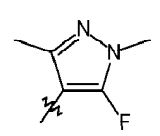
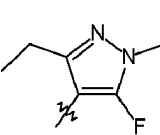
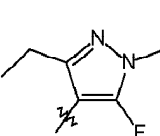
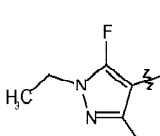
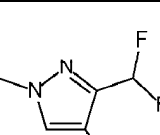
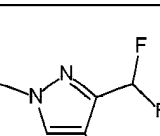
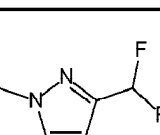
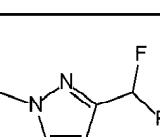
45

50

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
8		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	406	4,14
9		S	cPr	H	H	2-Cl-5-CF ₃	406	3,96
10		S	cPr	H	Pr	2,4-Cl ₂	414	4,97
11		S	cPr	H	H	2-cHex	386	5,17
12		S	cPr	H	H	2-I	430	3,68
13		S	cPr	H	H	2,4,6-Br ₃		4,86
14		S	cPr	H	H	2-IPr	346	3,89
15		S	cPr	H	Me	2,4-Cl ₂	386	4,14
16		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	386	4,06

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
17		S	cPr	H	Me	3-OBn	424	4,36
18		S	cPr	H	H	4-(2,4-Cl ₂ -фенокси)	464	5
19		S	cPr	H	Me	2,5-Cl ₂	386	4,04
20		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	434	
21		S	cPr	H	H	2-CH ₂ SiMe ₃	390	
22		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl	399	
23		S	cPr	H	H	2-iBu	360	
24		S	cPr	H	H	2-iPr	374	
25		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	424	

Пример No	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
5 26		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	434	
10 27		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	406	
15 28		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	420	4,54
20 29		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	438	
25 30		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃	420	
30 31		S	cPr	H	H	2-Br	400	3,46
35 32		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	404	4,01
40 33		S	cPr	H	H	3-OBn	426	4,06
45 34		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	424	3,71

50

5

10

15

20

25

30

35

40

45

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
35		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	424	4,09
36		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	424	4,01
37		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	394	4,49
38		S	cPr	H	H	H	322	
39		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	390	
40		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	452	
41		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-I	476	
42		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl		3,89
43		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	452	

50

5

10

15

20

25

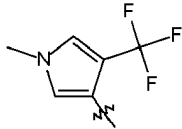
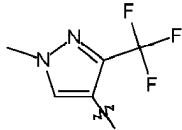
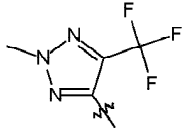
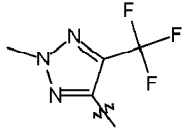
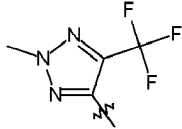
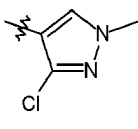
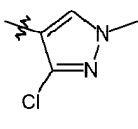
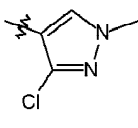
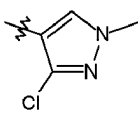
30

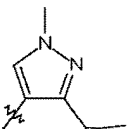
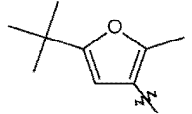
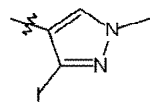
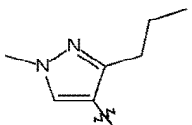
35

40

45

50

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
44		S	cPr	H	H	2-Cl-4,5-метиленидиоксо	417	4,01
45		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂ -4-OCF ₃	492	4,9
46		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	443	4,67
47		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	443	4,94
48		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	409	4,95
49		S	cPr	H	Me	3,5-Cl ₂		4,49
50		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	408	3,83
51		S	cPr	H	H	2-I		3,73
52		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃		4,49

Пример №	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
53		S	cPr	H	H	2-I	426	3,53
54		S	cPr	H	H	2-I	454	5,95
55		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂		3,71
56		S	cPr	H	Me	2,4-Cl ₂	396	4,39

Следующие примеры иллюстрируют неограничивающим образом приготовление и эффективность соединений формулы (I) согласно изобретению.

Пример получения:

Общий пример получения: осернение амида формулы (I) на аппарате Chemspeed (для автоматизированного химического синтеза)

В 13 мл Chemspeed сосуде взвешивают 0,27 ммоль пентасульфида фосфора (P₂S₅). Добавляют 3 мл 0,18 молярного раствора амида (I) (0,54 ммоль) в диоксане и смесь нагревают при кипении с обратным холодильником в течение двух часов.

Температуру затем снижают до 80°C и добавляют 2,5 мл воды. Смесь нагревают при 80°C в течение более одного часа. Затем добавляют 2 мл воды и реакционную смесь дважды экстрагируют 4 мл дихлорметана. Органическую фазу осаждают на картридже с оксидом алюминия (2 г) и элюируют дважды с помощью 8 мл дихлорметана. Растворители удаляют и сырое тиоамидное производное анализируют посредством ЖХМС(LCMS) и ЯМР. Недостаточно чистые соединения кроме того очищают препаративной ЖХМС.

Пример А: тест *in vivo* на *Alternaria brassicae* (альтернариоз крестоцветных)

Тестируемые активные ингредиенты готовят медленной гомогенизацией в смеси ацетон/Твин/вода. Суспензию затем разбавляют водой, чтобы получить требуемую концентрацию активного продукта.

Растения редьки (сорт Pernot), высеянные на 50/50 субстрат перегнойная почва/пуццолана в исходных чашках и выращенные при 18-20°C, обрабатывают на стадии семядолей опрыскиванием активным ингредиентом, приготовленным как описано выше.

Растения, используемые в качестве контролей, обрабатывают смесью ацетон/Твин/вода, не содержащей активный продукт.

Через 24 часа растения заражают опрыскиванием водной суспензией спор *Alternaria brassicae* (40000 спор на см³). Споры собирают от культуры в возрасте 12-13 суток.

Зараженные растения редьки инкубируют в течение 6-7 суток при примерно 18°C во влажной атмосфере.

Оценку проводят спустя 6-7 суток после заражения в сравнении с контрольными

растениями.

В данных условиях хорошая защита (по меньшей мере, 70%) наблюдается в дозе 500 ч./млн со следующими соединениями: 1, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 14, 16, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 42, 43 и 50.

Пример В: тест *in vivo* на *Pyrenophora teres* (сетчатая пятнистость ячменя)

Тестируемые активные ингредиенты готовят гомогенизацией в смеси ацетон/Твин/ДМСО, затем разбавляют водой, чтобы получить требуемую концентрацию активного продукта.

Растения ячменя (сорт Express), высейнные на 50/50 субстрат перегнойная почва/пуццолана в исходных чашках и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1-го листа (10 см высота) опрыскиванием активным ингредиентом, приготовленным как описано выше. Растения, используемые в качестве контролей, обрабатывают смесью ацетон/Твин/ДМСО/вода, не содержащей активный продукт.

Через 24 часа растения заражают опрыскиванием водной суспензией спор *Pyrenophora teres* (12000 спор на мл). Споры собирают от культуры в возрасте 12 суток. Зараженные растения ячменя инкубируют в течение 24 часов при примерно 20°C и 100% относительной влажности и затем в течение 12 суток при 80% относительной

влажности. Оценку проводят спустя 12 суток после заражения в сравнении с контрольными растениями.

В данных условиях хорошая (по меньшей мере, 70%) или тотальная защита наблюдается в дозе 500 ч./млн со следующими соединениями: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 42, 43, 44, 46, 50, 51, 52, 53 и 55.

Пример С: тест *in vivo* на *Sphaerotheca fuliginea* (мучнистая роса тыквы)

Тестируемые активные ингредиенты готовят гомогенизацией в смеси ацетон/Твин/вода. Затем данную суспензию разбавляют водой, чтобы получить требуемую концентрацию активного продукта.

Вест-индские тыквенные растения (сорт Vert petit de Paris) в исходных чашках, высейнные на 50/50 субстрат перегнойная почва/пуццолана и выращенные при 20°C/23°C, обрабатывают на стадии 2 листьев опрыскиванием водной суспензией, описанной выше. Растения, используемые в качестве контролей, обрабатывают водным раствором, не содержащим активный продукт.

Через 24 часа растения заражают опрыскиванием водной суспензией спор *Sphaerotheca fuliginea* (100000 спор на мл). Споры собирают от зараженных растений. Зараженные вест-индские растения инкубируют при примерно 20°C/25°C и при 60/70% относительной влажности.

Оценку проводят спустя 21 сутки после заражения в сравнении с контрольными растениями.

В данных условиях хорошая (по меньшей мере, 70%) или тотальная защита наблюдается в дозе 500 ч./млн со следующими соединениями: 3, 4, 5, 6, 8, 9, 10, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 28, 29, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 50, 51, 52, 53, 55 и 56.

Пример D: тест *in vivo* на *Micosphaerella graminicola* (микосфереллез пшеницы)

Тестируемые активные ингредиенты готовят гомогенизацией в смеси ацетон/Твин/ДМСО и затем разбавляют водой, чтобы получить требуемую концентрацию активного продукта.

Растения пшеницы (сорт Scipion), высейнные на 50/50 субстрат перегнойная

почва/пуццолана в исходных чашках и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1-го листа (10 см высота) опрыскиванием активным ингредиентом, приготовленным как описано выше.

Растения, используемые в качестве контролей, обрабатывают смесью ацетон/Твин/ДМСО/вода, не содержащей активный продукт.

Через 24 часа растения заражают опрыскиванием водной суспензией спор *Micosphaerella graminicola* (500000 спор на мл). Споры собирают от культуры в возрасте 7 суток. Зараженные растения пшеницы инкубируют в течение 72 часов при 18°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 21-28 суток при 90% относительной влажности.

Оценку (% эффективности) проводят спустя 21-28 суток после заражения в сравнении с контрольными растениями.

В данных условиях хорошая (по меньшей мере, 70%) или тотальная защита наблюдается в дозе 500 ч./млн со следующими соединениями: 1, 2, 4, 6, 7, 10, 11, 12, 14, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 31, 32, 34, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 46, 53, 55 и 56.

Пример Е по оценке эффективности: тест *in vivo* на *Puccinia recondita f. Sp. tritici* (бурая ржавчина пшеницы)

Тестируемые активные ингредиенты готовят гомогенизацией в смеси ацетон/Твин/ДМСО и затем разбавляют водой, чтобы получить требуемую концентрацию активного продукта.

Растения пшеницы (сорт Scipion), посеянные на 50/50 субстрат перегнойная почва/пуццолана в исходных чашках и выращенные при 12°C, обрабатывают на стадии 1-го листа (10 см высота) опрыскиванием активным ингредиентом, приготовленным как описано выше.

Растения, используемые в качестве контролей, обрабатывают смесью ацетон/Твин/ДМСО/вода, не содержащей активный продукт.

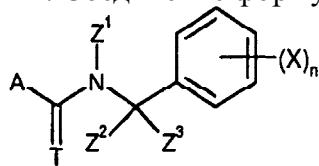
Через 24 часа растения заражают опрыскиванием листьев водной суспензией спор *Puccinia recondita* (100000 спор на мл). Споры собирают от зараженных растений пшеницы в возрасте 10 суток и суспендируют в воде, содержащей 2,5 мл/л 10% Твина 80. Зараженные растения пшеницы инкубируют в течение 24 часов при 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 10 суток при 20°C и при 70% относительной влажности.

Оценку проводят спустя 10 суток после заражения в сравнении с контрольными растениями.

В данных условиях хорошая (по меньшей мере, 70%) или тотальная защита наблюдается в дозе 500 ч./млн со следующими соединениями: 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 14, 16, 17, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 29, 32, 34, 36, 37, 38, 42, 50, 51 и 52.

Формула изобретения

1. Соединение формулы (I):



(I)

в которой

- А представляет собой карбосвязанную, ненасыщенную 5-членную гетероциклическую группу, выбранную из пиразолила, пирроллила, триазолила и фуридила, и которая может быть замещена вплоть до четырех заместителей группами R;

5

- Т представляет собой S;

- Z¹ представляет собой незамещенный C₃-C₇-циклоалкил или C₃-C₇-циклоалкил, замещенный вплоть до 2 заместителей, которые могут быть одинаковыми или различными и которые могут быть выбраны из перечня, состоящего из C₁-C₈-алкильных групп;

10

- Z² и Z³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода или C₁-C₈-алкил;

- X, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₁-C₈-галогеналкокси, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными; C₃-C₇-циклоалкил; три(C₁-C₈-алкил)силил; три(C₁-C₈-алкил)силил-C₁-C₈-алкил; бензилокси, фенокси, который может быть замещен вплоть до 2 заместителей группами Q;

15

20

фенил, который может быть замещен вплоть до 2 заместителей группами Q; или два заместителя X вместе с последующими атомами углерода, к которым они присоединены, образуют метилендиоксо;

25

- n представляет собой 1, 2 или 3;

- R, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₈-алкил; C₁-C₈-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- Q, который может быть одинаковым или различным, представляет собой атом галогена;

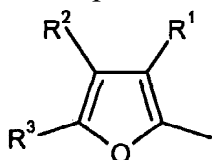
30

а также его сельскохозяйственно приемлемые соли.

2. Соединение по п.1, где А выбран из перечня, состоящего из

- гетероцикла формулы (A¹)

35



40

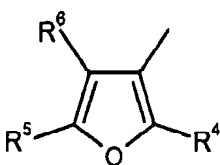
(A¹)

в которой

R¹ до R³, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

45

- гетероцикла формулы (A²)



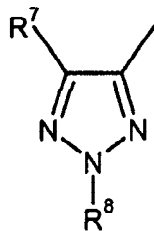
50

(A²)

в которой

R^4 до R^6 , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил; C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A³)



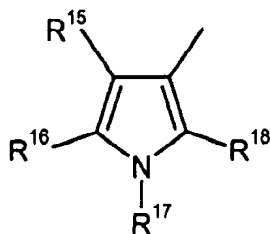
(A³)

в которой

R^7 представляет собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил; C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^8 представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

- гетероцикла формулы (A⁶)



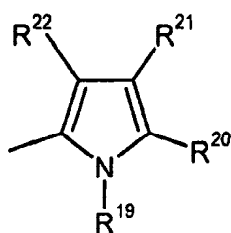
(A⁶)

в которой

R^{15} , R^{16} и R^{18} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил; или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{17} представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

- гетероцикла формулы (A⁷)

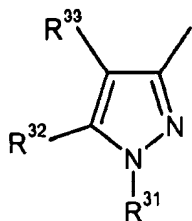


(A⁷)

в которой R^{19} представляет собой атом водорода или C_1 - C_5 -алкил;

R^{20} до R^{22} , которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C_1 - C_5 -алкил или C_1 - C_5 -галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A¹²)

(A¹²)

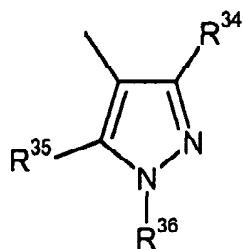
10 в которой

R³¹ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

R³² представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

15 R³³ представляет собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; или C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

- гетероцикла формулы (A¹³)

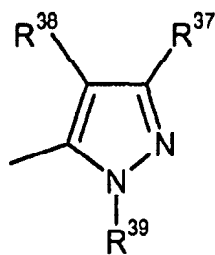
(A¹³)

25 в которой

30 R³⁴ и R³⁵, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₅-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

R³⁶ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил;

35 - гетероцикла формулы (A¹⁴)

(A¹⁴)

45 в которой

R³⁷ и R³⁸, которые могут быть одинаковыми или различными, представляют собой атом водорода; атом галогена; C₁-C₆-алкил; C₁-C₅-галогеналкил, содержащий вплоть до 3 атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными;

50 R³⁹ представляет собой атом водорода или C₁-C₅-алкил.

3. Соединение по п.2, где А выбран в перечне, состоящем из А²; А⁶ и А¹³.

4. Соединение по п.1, где Z¹ представляет собой незамещенный C₃-C₇-циклоалкил.

5. Соединение по п.1, где Z^1 представляет собой циклопропил.

6. Фунгицидная композиция, содержащая в качестве активного ингредиента эффективное количество соединения формулы (I) по пп.1-5 и сельскохозяйственно приемлемую подложку, носитель или наполнитель.

5

7. Способ борьбы с фитопатогенными грибами сельскохозяйственных культур, отличающийся тем, что агрономически эффективное и в основном нефитотоксичное количество соединения по пп.1-5 или композиции по п.6 применяется на почву, где растения растут или способны произрастать, на листья и/или плод растений или на

10

семена растений.

15

20

25

30

35

40

45

50