

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 201991311 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2019.12.30

(51) Int. Cl. C07C 257/18 (2006.01)
A01N 37/52 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2017.12.13

(54) ФЕНИЛАМИДИНЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ФУНГИЦИДОВ

(31) 16204169.3

(32) 2016.12.14

(33) EP

(86) PCT/EP2017/082602

(87) WO 2018/108998 2018.06.21

(71) Заявитель:

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ; БАЙЕР
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)

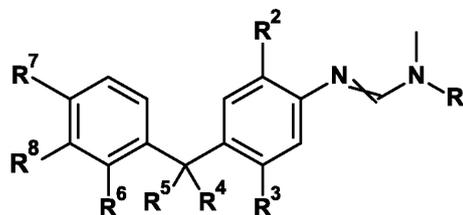
(72) Изобретатель:

Монтанье Сириль (FR), Эс-Сайед
Мазен, Гёртц Андреас, Вахендорфф-
Нойманн Ульрике (DE)

(74) Представитель:

Беляева Е.Н. (BY)

(57) Изобретение касается соединений формулы (I)



(I),

в частности фениламидинов формулы (I), способа их получения, применения фениламидинов формулы (I) в соответствии с изобретением для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности с фитопатогенными грибами, а также композиции для указанной цели, содержащей фениламидины формулы (I) в соответствии с изобретением. Кроме того, настоящее изобретение касается способа борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности с фитопатогенными грибами, отличающегося тем, что соединения формулы (I) наносят на микроорганизмы, в частности на фитопатогенные грибы, и/или место их произрастания.

A1

201991311

201991311

A1

Фениламидины и их применение в качестве фунгицидов

Настоящее изобретение касается соединений формулы (I), в частности, фениламидинов формулы (I), способа их получения, применения фениламидинов формулы (I) в соответствии с изобретением для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, с фитопатогенными грибами, а также композиции для указанной цели, содержащей фениламидины формулы (I) в соответствии с изобретением. Кроме того, настоящее изобретение касается способа борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, с фитопатогенными грибами, отличающегося тем, что соединения формулы (I) наносят на микроорганизмы, в частности, на фитопатогенные грибы и/или место их произрастания.

WO2000/046184 раскрывает применение амидинов, включая N-метил-N-метил-N'-[(4-фенокси)-2,5-ксилил]-формамина, в качестве фунгицидов.

WO2003/093224, WO2007/031512, WO2007/031513, WO2007/031523, WO2007/031524, WO2007/031526, WO2007/031527, WO2007/061966, WO2008/101682, WO2008/110279, WO2008/110280, WO2008/110281, WO2008/110312, WO2008/110313, WO2008/110314, WO2008/110315, WO2008/128639, WO2009/156098, WO2009/156074, WO2010/086118, WO2012/025450, WO2012/090969 и WO2014/157596 раскрывают применение производных ариламина в качестве фунгицидов.

WO2007/031508 и WO2007/093227 раскрывают применение производных ариламина в качестве фунгицидов и инсектицидов.

WO2003/024219 раскрывает композиции фунгицидов, содержащие, по меньшей мере, одно производное N2-фениламидина в комбинации с дополнительно выбранным известным активным соединением.

WO2004/037239 раскрывает антифунгицидные лекарственные препараты на основе производных N2-фениламидина.

WO2005/089547, WO2005/120234, WO2012/146125, WO2013/136275 и WO2014/037314 раскрывают смеси фунгицидов, содержащие, по меньшей мере, одно производное ариламина и дополнительно выбранный известный фунгицид.

WO2007/031507 раскрывает смеси фунгицидов, содержащие, по меньшей мере, одно производное ариламида и два других выбранных известных фунгицида.

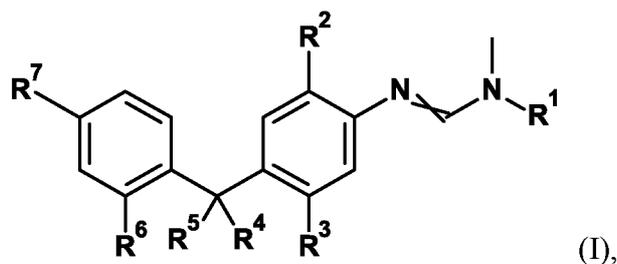
Эффективность фениламидинов, описанных в уровне техники, в качестве фунгицидов является довольно высокой, однако зачастую требуется улучшение спектра их действия, например, с точки зрения фунгицидной эффективности и/или используемой дозировки. В частности, может быть необходимо улучшение их фунгицидной эффективности.

Таким образом, целью настоящего изобретения является предоставление фениламидининов с улучшенной фунгицидной эффективностью и улучшенной совместимостью с растениями. В частности, целью настоящего изобретения является предоставление фениламидининов с улучшенной совместимостью с растениями.

Было обнаружено, что соединения формулы (I) согласно изобретению обеспечивают более высокую фунгицидную эффективность по сравнению с известными фениламидами. Кроме того, для соединений формулы (I) согласно изобретению наблюдался широкий спектр действия в отношении фитопатогенных грибов, с которыми осуществляют борьбу, то есть соединения формулы (I) согласно изобретению обладают улучшенной фунгицидной эффективностью.

Таким образом, применение соединений формулы (I) согласно изобретению значительно способствует достижению максимальной урожайности сельскохозяйственных культур и, следовательно, в конечном итоге, также обеспечивает качество и высокую урожайность в рамках сельскохозяйственного производства.

Соответственно, настоящее изобретение предоставляет фениламидины формулы (I)



в которой

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^2 и R^3 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

причем R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 и R^8 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, C_6 - C_{14} -арила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена, метила, галометила или C_1 - C_8 -алкокси;

причем R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

или в которой R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомами, с которыми они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена, и причем R^6 , R^7 и R^8 имеют вышеуказанные значения;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H, галогена, Me и Et, и причем R^6 , R^7 и R^8 имеют вышеуказанные значения.

Вышеуказанные определения радикалов, при необходимости, могут комбинироваться друг с другом.

Двойная связь N-C в формуле (I), представленная скрещенной линией, отражает возможную цис/транс стереохимию этой связи.

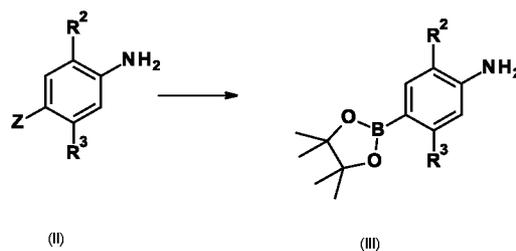
В соответствии с типом заместителей, определенным выше, соединения формулы (I) имеют основные свойства и могут образовывать соли, возможно, также внутренние соли или аддукты, с неорганическими или органическими кислотами или с ионами металлов. Соединения формулы (I) несут амидиновые группы, которые придают основные свойства. Таким образом, эти соединения могут реагировать с кислотами с образованием солей, или их получают непосредственно в ходе синтеза в виде солей.

Соли, которые могут быть получены таким путем, также обладают фунгицидными свойствами.

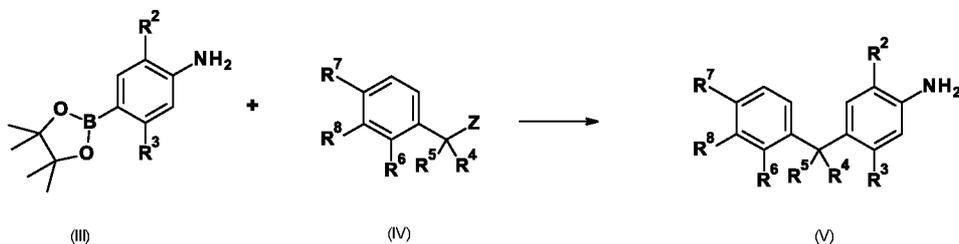
При необходимости, замещенные группы могут быть моно- или полизамещенными, при этом, в случае полизамещения, заместители могут быть идентичными или различными.

Кроме того, настоящее изобретение предоставляет способ получения фениламидинов в соответствии с изобретением, который включает, по меньшей мере, один из следующих этапов (a) - (g):

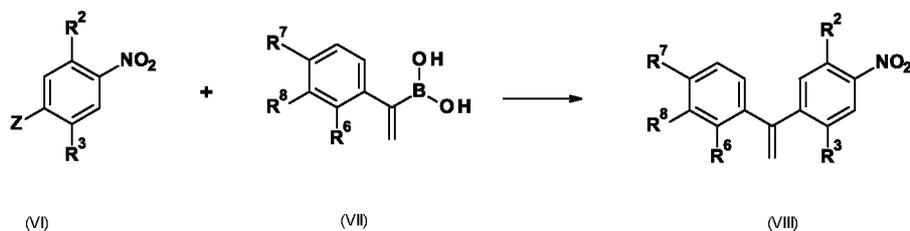
- (a) реакцию производных анилинов формулы (II) с получением производных формулы (III) в соответствии со схемой реакции ниже:



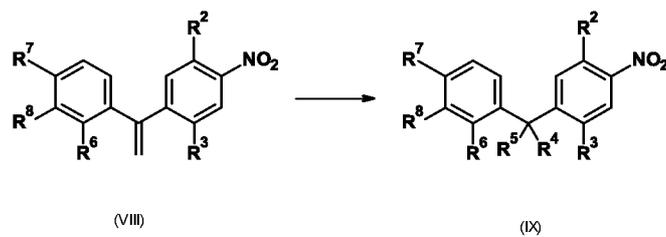
- (b) реакцию производных формулы (III) с производными бензила формулы (IV) с получением производных формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



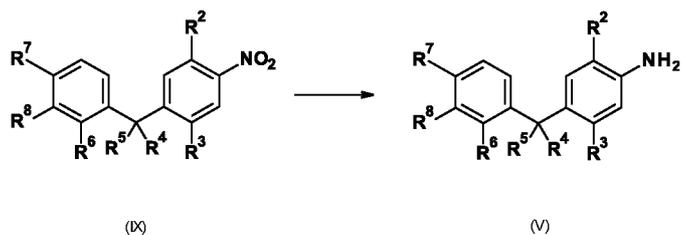
- (c) реакцию сочетания производных нитробензола формулы (VI) с бороновыми кислотами или сложными эфирами формулы (VII) с получением производных алкенила формулы (VIII) в соответствии со схемой реакции ниже:



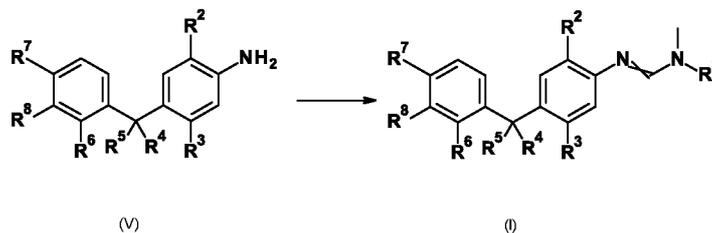
- (d) реакцию производных алкенила формулы (VIII) с получением производных циклопропила формулы (IX) в соответствии со схемой реакции ниже:



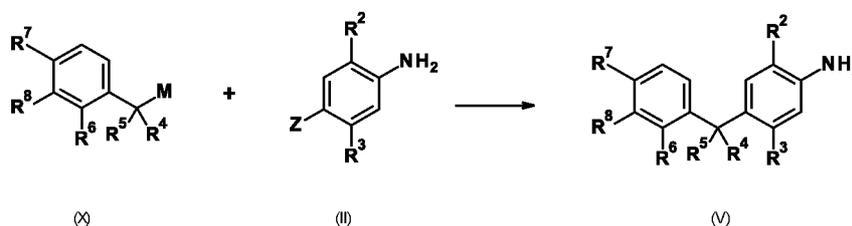
- (e) сокращение производных нитробензола формулы (IX) до производных анилина формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



- (f) реакцию анилинов формулы (V) с аминоацетальями с получением амидинов формулы (I) в соответствии со схемой ниже:



- (g) реакцию металлоорганического соединения формулы (X) с производными анилина формулы (II) с выходом анилинов формулы (V) в соответствии со схемой ниже:



где в вышеуказанных схемах

Z выбран из группы, состоящей из Cl, Br, I и OSO_2CF_3 ;

M выбран из группы, состоящей из MgZ и ZnZ;

$R^1 - R^8$ имеют указанные выше или ниже значения.

Третьим предметом изобретения является применение фениламидинов формулы (I) в соответствии с изобретением или содержащих их агрохимических препаративных форм для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, для борьбы с фитопатогенными грибами. композиции по п. 8 для борьбы с фитопатогенными грибами.

Четвертым предметом настоящего изобретения является агрохимическая препаративная форма для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, для борьбы с фитопатогенными грибами, содержащая, по меньшей мере, один фениламидин формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением.

Еще один предмет изобретения касается способа борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, для борьбы с фитопатогенными грибами, отличающегося тем, что фениламидины формулы (I) в соответствии с

изобретением или содержащие их агрохимические препаративные формы наносят на микроорганизмы и/или место их произрастания, в частности, на фитопатогенные грибы и/или место их произрастания.

Кроме того, изобретение дополнительно касается семян, которые обработали, по меньшей мере, одним соединением формулы (I).

В заключение, изобретение предоставляет способ защиты семян от нежелательных микроорганизмов, в частности, от фитопатогенных грибов, с помощью использования семян, обработанных, по меньшей мере, одним соединением формулы (I).

Общие определения

В связи с настоящим изобретением термин "галогены" (X) включает, если не указано иное, элементы, выбранные из группы, состоящей из фтора, хлора, брома и йода, где предпочтительно используют фтор, хлор и бром, и особенно предпочтительно используют фтор и хлор.

При необходимости, замещенные группы могут быть моно- или полизамещенными, при этом, в случае полизамещения, заместители могут быть идентичными или различными.

В определениях символов в вышеуказанных формулах используют собирательные понятия, которые, в целом, относятся к следующим заместителям:

Водород: Предпочтительно, определение водорода также включает изотопы водорода, предпочтительно дейтерий и тритий, более предпочтительно дейтерий.

Галоген: фтор, хлор, бром и йод и предпочтительно фтор, хлор, бром, и более предпочтительно фтор, хлор.

Галометил: метильная группа, в которой некоторые или все атомы водорода могут быть замещены атомами галогена, как указано выше, например (но не ограничиваясь ими), хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил.

Алкил: насыщенный разветвленный или неразветвленный гидрокарбильный радикал с 1 - 8 атомами углерода, предпочтительно 1 - 6, более предпочтительно 1 - 4 атомами углерода, например (но не ограничиваясь ими),

C₁-C₆-алкил, например, метил, этил, пропил (н-пропил), 1-метилэтил (изопропил), бутил (н-бутил), 1-метилпропил (втор-бутил), 2-метилпропил (изобутил), 1,1-диметилэтил (трет-бутил), пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил. В частности, указанная группа представляет собой группу C₁-C₄-алкила, например, группу метила, этила, пропила, 1-метилэтила (изопропила), бутила, 1-метилпропила (втор-бутила), 2-метилпропила (изобутила) или 1,1-диметилэтила (трет-бутила). Это определение также относится к алкилу как части составного заместителя, например, к циклоалкилалкилу, гидроксиалкилу и т.д., если в настоящем документе не задано иное определение, например, алкилсульфанил, алкилсульфинил, алкилсульфонил, галоалкил или галоалкилсульфанил.

Арил: моно-, би- или трициклическая ароматическая или частично ароматическая группа с 6 - 14 атомами углерода, например (но не ограничиваясь ими), фенил, нафтил, тетрагидронафтил, инденил и инданил. Связывание с вышестоящей общей структурой может осуществляться через любой возможный кольцевой член арильного остатка. Арил предпочтительно выбран из фенила, 1-нафтила и 2-нафтила. Особенно предпочтительным является фенил.

Циклоалкил: моноциклические насыщенные гидрокарбильные группы с 3 - 7, предпочтительно 3 - 6 членами углеродного кольца, например (но не ограничиваясь ими), циклопропил, циклопентил и циклогексил. Это определение также относится к циклоалкилу как части составного заместителя, например, к циклоалкилалкилу и т.д., если в настоящем документе не задано иное определение. Циклоалкилом особенно предпочтительно является циклопропил.

Гетероциклил: трех-семичленная, насыщенная или частично ненасыщенная гетероциклическая группа, содержащая, по меньшей мере, один, при необходимости, до четырех гетероатомов и/или гетерогрупп, независимо выбранных из группы, состоящей из N, O, P, S, S(=O) и S(=O)₂. Связывание с вышестоящей общей структурой может осуществляться через кольцевой атом углерода или, если это возможно, через кольцевой атом азота гетероциклической

группы. **Насыщенными гетероциклическими группами** в этом смысле являются, например (но не ограничиваясь ими), оксиранил, азиридирил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, тетрагидротиен-2-ил, тетрагидротиен-3-ил, пирролидин-2-ил, пирролидин-3-ил, изоксазолидин-3-ил, изоксазолидин-4-ил, изоксазолидин-5-ил, изотиазолидин-3-ил, изотиазолидин-4-ил, изотиазолидин-5-ил, пиразолидин-3-ил, пиразолидин-4-ил, пиразолидин-5-ил, оксазолидин-2-ил, оксазолидин-4-ил, оксазолидин-5-ил, тиазолидин-2-ил, тиазолидин-4-ил, тиазолидин-5-ил, имидазолидин-2-ил, имидазолидин-4-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-3-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-5-ил, 1,3,4-оксадиазолидин-2-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-3-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-5-ил, 1,3,4-тиадиазолидин-2-ил, 1,2,4-триазолидин-3-ил, 1,3,4-триазолидин-2-ил, пиперидин-2-ил, пиперидин-3-ил, пиперидин-4-ил, 1,3-dioxan-5-ил, тетрагидропиран-2-ил, тетрагидропиран-4-ил, тетрагидротиен-2-ил, гексагидропиридазин-3-ил, гексагидропиридазин-4-ил, гексагидропиримидин-2-ил, гексагидропиримидин-4-ил, гексагидропиримидин-5-ил, пиперазин-2-ил, 1,3,5-гексагидротриазин-2-ил и 1,2,4-гексагидротриазин-3-ил.

Частично ненасыщенными гетероциклическими группами в этом смысле являются, например (но не ограничиваясь ими), 2,3-дигидрофур-2-ил, 2,3-дигидрофур-3-ил, 2,4-дигидрофур-2-ил, 2,4-дигидрофур-3-ил, 2,3-дигидротиен-2-ил, 2,3-дигидротиен-3-ил, 2,4-дигидротиен-2-ил, 2,4-дигидротиен-3-ил, 2-пирролин-2-ил, 2-пирролин-3-ил, 3-пирролин-2-ил, 3-пирролин-3-ил, 2-изоксазолин-3-ил, 3-изоксазолин-3-ил, 4-изоксазолин-3-ил, 2-изоксазолин-4-ил, 3-изоксазолин-4-ил, 4-изоксазолин-4-ил, 2-изоксазолин-5-ил, 3-изоксазолин-5-ил, 4-изоксазолин-5-ил, 2-изотиазолин-3-ил, 3-изотиазолин-3-ил, 4-изотиазолин-3-ил, 2-изотиазолин-4-ил, 3-изотиазолин-4-ил, 4-изотиазолин-4-ил, 2-изотиазолин-5-ил, 3-изотиазолин-5-ил, 4-изотиазолин-5-ил, 2,3-дигидропиразол-1-ил, 2,3-дигидропиразол-2-ил, 2,3-дигидропиразол-3-ил, 2,3-дигидропиразол-4-ил, 2,3-дигидропиразол-5-ил, 3,4-дигидропиразол-1-ил, 3,4-дигидропиразол-3-ил, 3,4-дигидропиразол-4-ил, 3,4-дигидропиразол-5-ил, 4,5-дигидропиразол-1-ил, 4,5-дигидропиразол-3-ил, 4,5-дигидропиразол-4-ил, 4,5-дигидропиразол-5-ил, 2,3-дигидрооксазол-2-ил, 2,3-дигидрооксазол-3-ил, 2,3-дигидрооксазол-4-ил, 2,3-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил, 3,4-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил. Это определение также относится к гетероциклилу как части составного заместителя, например к

гетероциклическому и т.д., если в настоящем документе не задано иное определение.

Не включены комбинации, которые противоречат законам природы и которые, таким образом, исключил бы специалист в данной области, основываясь на своих знаниях.

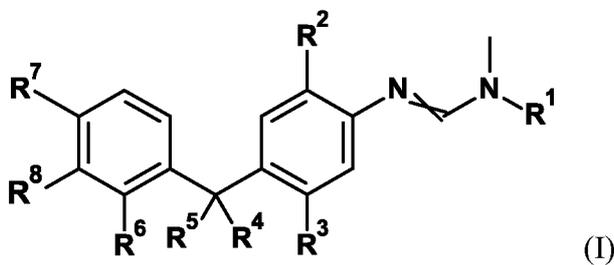
Изомеры

В зависимости от свойств заместителей, соединение согласно изобретению может присутствовать в виде различных стереоизомеров. Такими стереоизомерами могут быть, например, энантимеры, диастереомеры, атропоизомеры или геометрические изомеры. Соответственно изобретение относится как к чистым изомерам, так и к любым смесям данных изомеров. В тех случаях, когда соединение может присутствовать в двух или более таутомерных формах в равновесии, в случае, если по тексту упоминается одна таутомерная форма соединения, то такое упоминание включает все таутомерные формы.

Соли

В зависимости от свойств заместителей, соединение согласно изобретению может присутствовать в виде свободного соединения и/или в виде фармацевтически приемлемой соли. Термин "фармацевтически приемлемая соль" относится к соли соединения по настоящему изобретению с кислотами или основаниями, которые могут быть использованы в сельском хозяйстве.

Фениламидины в соответствии с изобретением представляют собой соединения формулы (I)



или их соли, N-оксиды, комплексы металлов и их стереоизомеры.

В формуле (I), группы имеют нижеприведенные значения. Приведенные определения также относятся ко всем промежуточным веществам:

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^2 и R^3 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

причем R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 и R^8 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, C_6 - C_{14} -арила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена, метила, галометила или C_1 - C_8 -алкокси;

причем R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

или в которой R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомами, с которыми они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена, и причем R^6 , R^7 и R^8 имеют вышеуказанные значения;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H, галогена, Me и Et, и причем R^6 , R^7 и R^8 имеют вышеуказанные значения.

В формуле (I), группы имеют альтернативно нижеприведенные значения. Приведенные определения также относятся ко всем промежуточным веществам:

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^2 и R^3 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

причем

R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, C_2 - C_8 -алкенила, C_2 - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

причем R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

или в которой R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомами, с которыми они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо; и

R^8 представляет собой H.

В формуле (I), группы имеют *предпочтительные* нижеприведенные значения. Определения, приведенные как являющиеся *предпочтительными*, подобным образом относятся ко всем промежуточным соединениям:

R^1 *предпочтительно* выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила,

R^2 *предпочтительно* выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^3 *предпочтительно* выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^4 и R^5 *предпочтительно* выбраны из группы, состоящей из H, галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

или R^4 и R^5 могут *предпочтительно* образовывать вместе с атомами, с которым они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут *предпочтительно* образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H, F, Cl, Me и Et;

R^6 , R^7 и R^8 предпочтительно независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, циано, Me, метокси, фенила и фенила, замещенного одним или более заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, Me и CF_3 .

В формуле (I), радикалы имеют *особенно предпочтительные* нижеприведенные значения. Определения, приведенные как являющиеся *особенно предпочтительными*, подобным образом относятся ко всем промежуточным соединениям:

R^1 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, Et, iPr;

R^2 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, циано, Cl, Br, I, CHF_2 , CF_3 ;

R^3 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, циано, F, Cl, Br, I;

R^4 и R^5 , каждый независимо *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H;

или R^4 и R^5 могут *особенно предпочтительно* образовывать вместе с атомами, с которым они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут *особенно предпочтительно* образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

R^6 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F;

R^7 и R^8 представляют собой *особенно предпочтительно* H;

В формуле (I), радикалы имеют альтернативно *особенно предпочтительные* нижеприведенные значения. Определения, приведенные как являющиеся *особенно предпочтительными*, подобным образом относятся ко всем промежуточным соединениям:

R^1 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила,

R^2 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

R^3 *особенно предпочтительно* выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

R^4 и R^5 *особенно предпочтительно* выбраны из группы, состоящей из H, галоген, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или R^4 и R^5 могут *особенно предпочтительно* образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, 3- 6-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила, который может быть, при необходимости, замещен одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут *особенно предпочтительно* образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из водорода, F, Cl, Me и Et;

R^6 , R^7 и R^8 *особенно предпочтительно* независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, циано, Me, метокси и фенила.

В формуле (I), радикалы имеют *более предпочтительно* нижеприведенные значения. Определения, приведенные как являющиеся *более предпочтительными*, подобным образом относятся ко всем промежуточным соединениям:

R^1 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, Et, iPr;

R^2 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, циано, Cl, Br, I, CHF_2 , CF_3 ;

R^3 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, iPr, циано, F, Cl, Br, I;

R^4 и R^5 *более предпочтительно*, каждый независимо выбран из группы, состоящей из H и Me;

или R^4 и R^5 могут *более предпочтительно* образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, циклопропил, который может быть, при необходимости, замещен одной или более группами, выбранными из группы, состоящей из F, Cl и Br;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут *более предпочтительно* образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

R^6 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F, Cl, метокси и фенила;

R^7 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H и F, и

R^8 *более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H и F.

В формуле (I), радикалы имеют *еще более предпочтительные* нижеприведенные значения. Определения, приведенные как являющиеся *еще более предпочтительными* подобным образом относятся ко всем промежуточным соединениям:

R^1 *еще более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Et и iPr;

R^2 *еще более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me и Cl;

R^3 *еще более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из Me, F и Cl;

R^4 *еще более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H и Me, и

R^5 *еще более предпочтительно* H;

или R^4 и R^5 могут *еще более предпочтительно* образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, циклопропил, который может быть, при необходимости, замещен одним или двумя F;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут *еще более предпочтительно* образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

R^6 *еще более предпочтительно* выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F и Cl;

R^7 еще более предпочтительно выбран из группы, состоящей из H и F, и

R^8 еще более предпочтительно выбран из группы, состоящей из H и F.

Соединениями в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно являются соединения формулы (I), выбранные из группы, состоящей из Таблицы 1:

Таблица 1: Предпочтительные фениламидины в соответствии с настоящим изобретением; CN = циано; iPr = изопропил;

Пример	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8
1	Et	Cl	Me	H	H	CN	H	H
2	Et	Cl	Me	H	H	F	H	H
3	Et	Cl	Me	H	H	H	H	H
4	Et	Me	Cl	H	H	CN	H	H
5	Et	Me	Cl	H	H	F	H	H
6	Et	Me	Cl	H	H	H	H	H
7	Et	Me	Me	H	H	Cl	H	H
8	Et	Me	Me	H	H	CN	H	H
9	Et	Me	Me	H	H	F	F	H
10	Et	Me	Me	H	H	F	H	H
11	Et	Me	Me	H	H	H	H	H
12	iPr	Me	Me	H	H	F	F	H
13	Et	Me	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H	H
14	Et	Me	Me	-CF ₂ -CH ₂ -		H	H	H
15	Et	Me	Me	-CCl ₂ -CH ₂ -		H	H	H
16	Et	Me	Me	-CBr ₂ -CH ₂ -		H	H	H
18	Et	Me	Cl	Me	H	H	H	H
19	Et	Me	Cl	=CH ₂		H	H	H
20	Et	Me	F	H	H	H	H	H
21	Et	Cl	Me	H	H	F	F	H
22	Et	Me	Cl	H	H	F	F	H
23	Et	Me	Cl	H	H	Me	H	H
24	Et	Me	Cl	H	H	F	H	F
25	Et	Me	Cl	H	H	Ph	H	H
26	Et	Cl	Me	H	H	OMe	H	H

Пример	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
27	Et	Cl	Me	Me	H	H	H	H
28	Et	Cl	Me	H	H	Cl	H	H
29	Et	Me	Cl	H	H	OMe	H	H
30	Et	Me	Cl	H	H	Cl	H	H
31	Et	Cl	Me	=CH ₂		H	H	H
32	Et	Me	F	H	H	OMe	H	H
33	Et	Me	F	H	H	F	H	H
34	Et	Me	F	Me	H	H	H	H
35	Et	Me	F	H	H	F	F	H
36	Et	Me	iPr	H	H	F	H	H
37	Et	Me	iPr	H	H	CN	H	H
38	Et	Me	cPr	H	H	F	H	H
39	Et	Me	cPr	H	H	CN	H	H
40	iPr	Me	iPr	H	H	F	H	H
41	iPr	Me	iPr	H	H	CN	H	H
42	iPr	Me	cPr	H	H	F	H	H
43	iPr	Me	cPr	H	H	CN	H	H
44	Et	F	Me	H	H	H	H	H
45	Et	Cl	Me	H	H	H	H	H
46	iPr	Cl	Me	H	H	H	H	H
47	Et	CN	Me	H	H	H	H	H
48	Et	CF ₃	Me	H	H	H	H	H
49	Et	CHF ₂	Me	H	H	H	H	H
50	Et	Br	Me	H	H	H	H	H
51	Et	I	Me	H	H	H	H	H
52	Et	cPr	Me	H	H	H	H	H
53	Et	iPr	Me	H	H	H	H	H
54	Et	C≡CH	Me	H	H	H	H	H

Соединения формулы (I) несут амидиновые группы, которые придают основные свойства. Таким образом, эти соединения могут реагировать с кислотами с образованием солей.

Примерами неорганических кислот являются галогенводородные кислоты, такие как фторводород, хлороводород, бромоводород и иодоводород, серная кислота, ортофосфорная кислота и азотная кислота, а также соли кислот, такие как NaHSO_4 и KHSO_4 .

Органические кислоты включают, например, муравьиную кислоту, карбоновую кислоту и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, щавелевая кислота, насыщенные или моно- или диненасыщенные C_6 - C_{20} жирные кислоты, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилсульфоновые кислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две группы сульфоновой кислоты), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два радикала фосфоновой кислоты), где алкильные и арильные радикалы могут нести дополнительные заместители, например, п-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, п-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота и т.д.

Применимыми ионами металлов являются, в частности, ионы элементов второй группы главной подгруппы, в частности, кальций и магний, третьей и четвертой группы главной подгруппы, в частности, алюминий и олово, а также элементы побочных подгрупп групп с первой по восьмую, в частности, марганец, железо, кобальт, никель, медь, цинк и другие. Особенно предпочтительными являются ионы металлов четвертого периода. Металлы могут присутствовать в разных валентностях, которые они могут иметь.

Получение фениламидинов формулы (I) в соответствии с изобретением

Фениламидины формулы (I) в соответствии с изобретением могут быть получены способом, показанным на схеме (I) ниже:

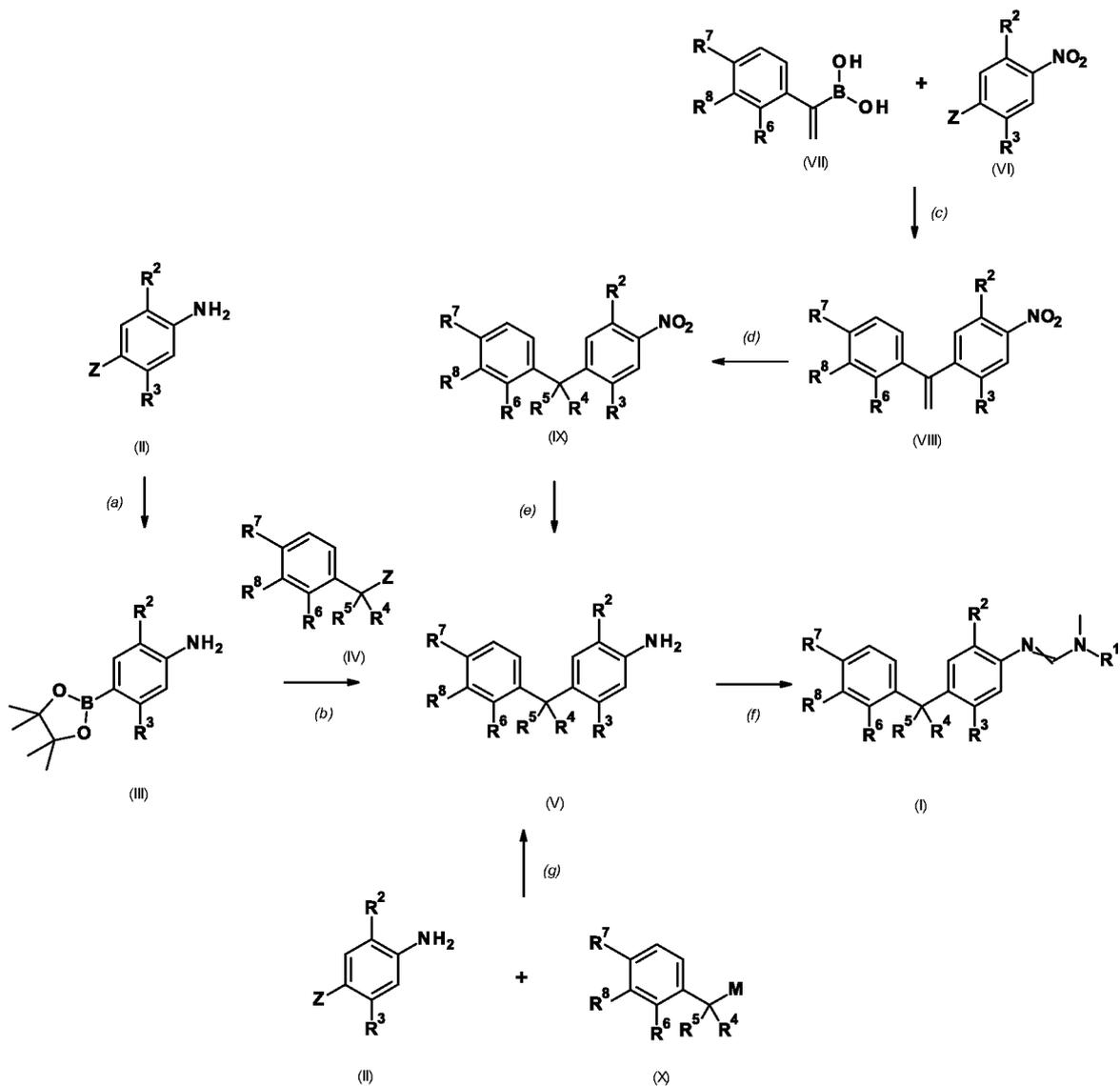


Схема (I)

где в вышеуказанных схемах

Z выбран из группы, состоящей из Cl, Br, I и OSO_2CF_3 ;

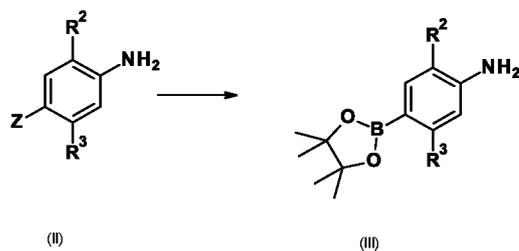
M выбран из группы, состоящей из MgZ и ZnZ ;

$R^1 - R^8$ имеют вышеуказанные значения;

Этап (a)

В одном варианте осуществления в соответствии с изобретением, производные анилинов формулы (II) подвергают реакции с биспинаколдиборонем

с получением соответствующих бороновых сложных эфиров формулы (III) в соответствии со схемой реакции ниже:



Соответствующими группами (Z) являются все заместители, имеющие достаточную реакционную способность в преобладающих условиях реакции. В качестве примеров соответствующих групп (Z) можно упомянуть галогены и трифлат.

Такие сочетания могут осуществляться способами, описанными в литературе (см., например, "Palladium in heterocyclic chemistry" (Палладий в гетероциклической химии), Pergamon Press, 2000; 1^{oe} издание, J. Li & G. Gribble) путем реакции сочетания, при необходимости, в присутствии катализатора, предпочтительно катализатора на основе переходного металла, например, на основе солей меди, солей палладия или палладиевых комплексов, например, хлорида палладия (II), ацетата палладия (II), тетраakis-(трифенилфосфин) палладия(0), дихлорида бис-(трифенилфосфин) палладия (II), трис(дибензилиденацетон) дипалладия (0), бис(дибензилиденацетон) палладия (0) или хлорида 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен-палладия (II). В качестве альтернативы палладиевый комплекс получают непосредственно в реакционной смеси путем добавления в реакционную смесь по отдельности соли палладия и комплексного лиганда, такого как фосфин, например, триэтилфосфин, три-трет-бутилфосфин, трициклогексилфосфин, 2-(дициклогексилфосфин)-бифенил, 2-(ди-трет-бутилфосфин)бифенил, 2-(дициклогексилфосфин)-2'-(N,N-диметиламино)-бифенил, трифенилфосфин, трис-(о-толил)фосфин, 3-(дифенилфосфино)бензосульфат натрия, трис-2-(метоксифенил)фосфин, 2,2'-бис-(дифенилфосфин)-1,1'-бинафтил, 1,4-бис-(дифенилфосфин)бутан, 1,2-бис-(дифенилфосфин)этан, 1,4-бис-(дициклогексилфосфин)бутан, 1,2-бис-(дициклогексилфосфин)этан, 2-(дициклогексилфосфин)-2'-(N,N-диметиламино)-бифенил, бис(дифенилфосфино)ферроцен, трис-(2,4-трет-бутилфенил)-фосфит, (R)-(-)-1-[(S)-2-(дифенилфосфино)ферроценил]этилди-трет-бутилфосфин, (S)-(+)-

1-[(R)-2-(дифенилфосфино)ферроценил]этилдициклогексилфосфин, (R)-(-)-1-[(S)-2-(дифенилфосфино)ферроценил]этилдициклогексилфосфин, (S)-(+)-1-[(R)-2-(дифенилфосфино)ферроценил]этилди-трет-бутилфосфин.

Такие реакции сочетания, при необходимости, проводятся в присутствии основания, например, органического или неорганического основания; предпочтительно, в присутствии гидрида, гидроксида, амида, алкоголята, ацетата, карбоната или гидрокарбоната щелочного или щелочноземельного металла, например, гидрида натрия, амида натрия, диизопропиламида лития, метанолата натрия, этанолата натрия, трет-бутанолата калия, ацетата натрия, ацетата калия, ацетата кальция, гидроксида натрия, гидроксида калия, карбоната натрия, карбоната калия, бикарбоната калия, бикарбоната натрия, карбоната цезия или карбоната аммония; а также третичного амина, такого как триметиламин, триэтиламин (TEA), трибутиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диметилбензиламин, N,N-диизопропил-этиламин (DIPEA), пиридин, N-метилпиперидин, N-метилморфолин, N,N-диметиламинопиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN) или диазабициклоундецен (DBU).

Реакция может быть проведена в чистом виде или в растворителе; предпочтительно, реакцию проводят в растворителе, выбранном из стандартных растворителей, которые являются инертными в преобладающих условиях реакции.

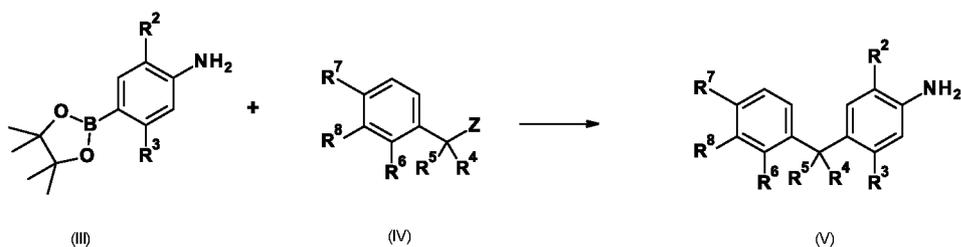
Предпочтительно используют алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как, например, петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин, галогенированные углеводороды, такие как, например, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрагидрид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропил эфир, метил-трет-бутиловый эфир (MTBE), метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как, например, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон (NMP) или гексаметиленфосфорный триамид; и их смеси с водой, в частности, с дистиллированной водой.

Реакция может проводиться при пониженном давлении, при атмосферном давлении или при давлении выше атмосферного и при температуре в диапазоне -20 - 200 °С; предпочтительно, реакцию проводят при атмосферном давлении и температуре в диапазоне 50 - 150 °С.

Производные анилина формулы (II) являются коммерчески доступными или могут быть получены из коммерчески доступных прекурсоров способами, описанными в литературе.

Этап (b)

В соответствии с альтернативными вариантами осуществления изобретения производные сложного эфира боринной кислоты формулы (III) могут вступать в реакцию с производными бензила формулы (IV) с получением производных анилинов формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



Соответствующими группами (Z) являются все заместители, имеющие достаточную реакционную способность в преобладающих условиях реакции. В качестве примеров соответствующих групп (Z) можно упомянуть галогены и трифлат.

Реакция может быть осуществлена в условиях, схожих с условиями, описанными на этапе (a)

Производные бензила формулы (IV) являются коммерчески доступными или могут быть получены из коммерчески доступных прекурсоров способами, описанными в литературе.

Этап (c)

Производные нитрофенила формулы (VI) могут быть подвергнуты реакции с производными алкенил-бороновой кислоты формулы (VII) в соответствии со схемой реакции ниже с получением производных алкенила формулы (VIII):

бикарбоната натрия, карбоната цезия или карбоната аммония; а также третичного амина, например, триметиламина, триэтиламина (TEA), трибутиламина, N,N-диметиланилина, N,N-диметил-бензиламина, N,N-диизопропил-этиламина (DIPEA), пиридина, N-метилпиперидина, N-метилморфолина, N,N-диметиламинопиридина, диазабициклооктана (DABCO), диазабициклононена (DBN) или диазабициклоундецена (DBU).

В качестве альтернативы, реакция может проводиться с использованием галоацетатной соли (например, $\text{BrCF}_2\text{CO}_2\text{Na}$) или соответствующей галогенуксусной кислоты в присутствии соответствующего основания в соответствии с описанием выше.

В качестве альтернативы, реакция может проводиться с использованием дигалогенметана (например, дийодметана) в присутствии переходного металла или производного переходного металла (например, диэтилцинка).

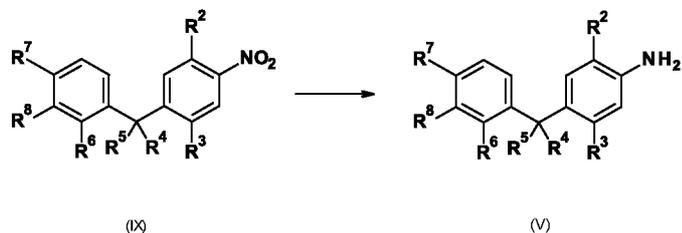
Реакция может быть проведена в чистом виде или в растворителе; предпочтительно, реакцию проводят в растворителе, выбранном из стандартных растворителей, которые являются инертными в преобладающих условиях реакции.

Предпочтительно используют алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как, например, петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин, галогенированные углеводороды, такие как, например, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропил эфир, метил-трет-бутиловый эфир (MTBE), метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, n- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как, например, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон (NMP) или гексаметиленфосфорный триамид; и их смеси с водой, в частности, с дистиллированной водой.

Реакция может проводиться при пониженном давлении, при атмосферном давлении или при давлении выше атмосферного и при температуре в диапазоне $-20 - 200$ °C; предпочтительно, реакцию проводят при атмосферном давлении и температуре в диапазоне $0 - 150$ °C.

Этап (e)

Производные нитрофенила формулы (VIII) могут быть восстановлены до производных анилина формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



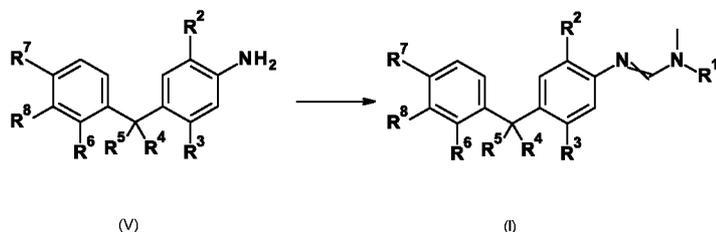
Восстановление в соответствии с этапом (e) может осуществляться любыми способами восстановления нитрогрупп, известными из уровня техники.

Предпочтительно восстановление проводят с использованием хлорида олова в соответствии с описанием в WO2000/46184. Однако, в качестве альтернативы, восстановление также может осуществляться с использованием железа в присутствии соляной кислоты или газообразного водорода, при необходимости, в присутствии соответствующих катализаторов гидрогенизации, таких как, например, никель Ренея или Pd/C. Условия реакции описаны в предшествующем уровне техники и известны специалистам.

Если восстановление проводится в жидкой фазе, реакция должна протекать в растворителе, инертном к преобладающим условиям реакции. Примерами таких растворителей являются, например, толуол, метанол или этанол.

Этап (f)

Конверсия анилина формулы (V) в амидины формулы (I) может осуществляться как показано ниже:

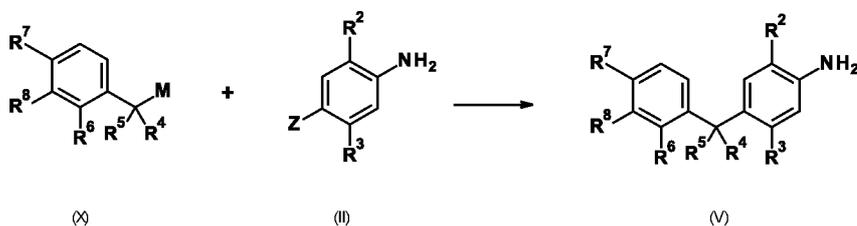


Реакция в соответствии с этапом (f) предпочтительно проводится в присутствии аминоацетала формулы $\text{MeR}_1\text{NCH}(\text{OMe})_2$ и предпочтительно в отсутствие основания или кислоты.

Реакцию предпочтительно проводят в растворителе, выбранном из стандартных растворителей, которые являются инертными в преобладающих условиях реакции. Предпочтительно используют алифатические, алициклические или ароматические углеводороды, такие как, например, петролейный эфир, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин, галогенированные углеводороды, такие как, например, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как, например, диэтиловый эфир, диизопропил эфир, метил-трет-бутиловый эфир (MTBE), метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, *n*- или изобутиронитрил или бензонитрил; амиды, такие как, например, *N,N*-диметилформамид (DMF), *N,N*-диметилацетамид, *N*-метилформанилид, *N*-метилпирролидон (NMP) или гексаметиленфосфорный триамид, сложные эфиры, такие как, например, метилацетат или этилацетат; сульфоксиды, такие как, например, диметилсульфоксид (DMSO); сульфоны, такие как, например, сульфолан; спирты, такие как, например, метанол, этанол, *n*- или изопропанол, *n*-, изо-, втор- или трет-бутанол, этандиол, пропан-1,2-диол, этоксиэтанол, метоксиэтанол, монометиловый эфир диэтиленгликоля, моноэтиловый эфир этиленгликоля или смеси указанных соединений.

Этап (g)

Конверсия металлоорганических соединений формулы (X) в анилины формулы (V) может осуществляться как показано ниже:



Соответствующими группами (Z) являются все заместители, имеющие достаточную реакционную способность в преобладающих условиях реакции. В качестве примеров соответствующих групп (Z) можно упомянуть галогены и трифлат.

Соответствующими группами (M) являются все заместители, имеющие достаточную реакционную способность в преобладающих условиях реакции. В качестве примеров соответствующих групп (Z) можно упомянуть MgZ и ZnZ.

Реакция может быть осуществлена в условиях, схожих с условиями, описанными на этапе (а)

Металлоорганические соединения формулы (X) являются коммерчески доступными или могут быть получены из коммерчески доступных прекурсоров способами, описанными в литературе.

На вышеуказанных схемах

Z выбран из группы, состоящей из Cl, Br, I и OSO₂CF₃;

M выбран из группы, состоящей из MgZ и ZnZ;

R¹ - R⁸ имеют значения, указанные в данном документе.

Композиции/препаративные формы

Настоящее изобретение дополнительно касается композиции, в частности, композиции для борьбы с нежелательными микроорганизмами, в частности, с фитопатогенными грибами. Композиции могут наноситься на микроорганизмы, в частности, на фитопатогенные грибы и/или место их произрастания. Термин “композиции” охватывает агрохимические препаративные формы.

Композиция обычно содержит, по меньшей мере, одно соединение формулы (I) и, по меньшей мере, одно агрономически приемлемое вспомогательное вещество, например носитель(-и) и/или поверхностно-активное вещество(-а).

Носитель представляет собой твердое или жидкое, природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, которое обычно является инертным. Как правило, носитель повышает эффективность нанесения соединений, например, на растения, части растений или на семена. Примеры соответствующих твердых носителей включают, помимо прочего, соли аммония, порошок естественной горной породы, например, каолины, глины, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит и диатомовую землю, и порошок синтетической горной породы, например, тонкоизмельченный диоксид кремния, глинозем и силикаты. Примеры обычно используемых твердых носителей для получения гранул включают, помимо прочего: измельченные и

фракционированные естественные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит и доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических мук и грануляты из органического материала, такого как бумага, опилки, скорлупа кокосового ореха, початки кукурузы и стебли табака. Примеры соответствующих жидких носителей включают, помимо прочего, воду, органические растворители и их комбинации. Примеры соответствующих растворителей включают полярные и неполярные органические химические жидкости, например, из классов ароматических и неароматических углеводородов (таких как циклогексан, парафины, алкилбензолы, ксилол, толуол, алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения или хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или метилхлорид), спирты и полиолы (которые, при необходимости, могут также быть замещены, образовывать простой и/или сложный эфир), кетоны (такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон), сложные эфиры (включая жиры и масла) и (поли)эфиры, незамещенные и замещенные амины, амиды (такие как диметилформамид), лактамы (такие как N-алкилпирролидоны) и лактоны, сульфоны и сульфоксиды (такие как диметилсульфоксид). Носителем также может являться сжиженный газовый разбавитель т.е. жидкость, которая при обычной температуре и обычном давлении находится в газообразном состоянии, например, аэрозольные пропелленты, такие как галогенуглеводороды, бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

Поверхностно-активное вещество может представлять собой ионное (катионное или анионное) или неионное поверхностно-активное вещество, такое как ионный или неионный эмульгатор(-ы), пенообразователь(-и), диспергатор(-ы), смачивающий агент(-ы) и любые их смеси. Примеры соответствующих ПАВ включают, помимо прочего, соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой или нафталинсульфоновой кислоты, поликонденсаты этиленоксида и/или пропиленоксида с жирными спиртами, жирными кислотами или с аминами жирного ряда (сложные эфиры полиоксиэтиленовых жирных кислот, простые эфиры полиоксиэтиленовых жирных спиртов, например простые эфиры алкиларилполигликоля), замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаураты),

эфиры фосфорной кислоты полиокситилатных спиртов или фенолов, эфиры жирной кислоты полиолов и производные данных соединений, содержащие сульфаты, сульфонаты и фосфаты (например, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты) и белковые гидролизаты, лигносульфитный щелок и метилцеллюлоза. Поверхностно-активное вещество обычно используют, когда соединение формулы (I) и/или носитель являются нерастворимыми в воде, а нанесение осуществляют с использованием воды. В этом случае количество поверхностно-активных веществ обычно составляет 5 - 40 мас.% композиции.

Другие примеры соответствующих вспомогательных веществ включают водоотталкивающие агенты, сиккативы, связующие вещества (адгезивы, вещества для повышения клейкости, закрепители, такие как карбоксиметилцеллюлоза, натуральные и синтетические полимеры в форме порошков, гранул или латексных дисперсий, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт и поливинилацетат, натуральные фосфолипиды, такие как цефалины и лецитины и синтетические фосфолипиды, поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилоза), загустители, стабилизаторы (например, стабилизаторы холода, консерванты, антиоксиданты, светостабилизаторы или другие агенты, улучшающие химическую и/или физическую стабильность), красители или пигменты (такие как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана и берлинская синь; органические красители, например, ализарин, азо- и фталоцианиновые металлические красители), пеногасители (например, силиконовые пеногасители и стеарат магния), консерванты (например, дихлорфен и полуформаль бензилового спирта), вторичные загустители (производные целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантан, модифицированные глины и тонкоизмельченный диоксид кремния), клейкие вещества, гиббереллины и технологические вспомогательные средства, минеральные и растительные масла, ароматизирующие вещества, воски, питательные вещества (включая микроэлементы, такие как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинк), защитные коллоиды, тиксотропные вещества, пенетранты, секвестранты и комплексообразователи.

Выбор вспомогательных веществ зависит от предполагаемого способа применения соединения формулы (I) и/или с его физическими свойствами. Кроме того, вспомогательные вещества могут быть выбраны таким образом, чтобы

придать определенные свойства (технические, физические и/или биологические свойства) композициям или формам для использования, полученным из таких соединений. Путем выбора соответствующих вспомогательных веществ можно изготавливать композиции в зависимости от конкретных потребностей.

Композиция согласно изобретению может быть в любой обычной форме, такой как раствор (например, водный раствор), эмульсия, смачиваемый порошок, суспензия на водной или масляной основе, порошок, пылевидный препарат, паста, растворимый порошок, растворимые гранулы, гранулы для разбросного внесения, концентраты суспензии, натуральные или синтетические продукты, пропитанные соединением согласно изобретению, удобрения, а также микрокапсуляции в полимерном веществе. Соединение согласно изобретению может присутствовать в форме суспензии, эмульсии или раствора.

Композиция согласно изобретению может предоставляться конечному пользователю в виде препарата, готового к применению, то есть композиции могут наноситься непосредственно на растения или семена с помощью подходящего устройства, такого как опрыскиватель или распылитель. В качестве альтернативы, композиции могут предоставляться конечному пользователю в виде концентратов, которые перед использованием необходимо разбавлять, предпочтительно водой.

Композиция согласно изобретению может быть приготовлена обычными способами, например, путем смешивания соединения согласно изобретению с одним или несколькими соответствующими вспомогательными веществами, такими как вещества, описанные в настоящем документе выше.

Композиции в соответствии с изобретением, как правило, содержат 0,01 - 99 мас.% соединения согласно изобретению, 0,05 - 98 мас.%, предпочтительно 0,1 - 95 мас.%, более предпочтительно 0,5 - 90 мас.%, наиболее предпочтительно 10 - 70 мас.% соединения согласно изобретению.

Смеси/Комбинации

Соединение и композиция согласно изобретению могут смешиваться с другими активными ингредиентами, такими как фунгициды, бактерициды, акарициды, нематоциды, инсектициды, гербициды, удобрения, регуляторы роста, антитоксины или химические сигнальные вещества. Это может позволить расширить спектр активности или предотвратить развитие устойчивости. Примеры известных

фунгицидов, инсектицидов, акарицидов, нематоцидов и бактерицидов описаны в справочнике "Pesticide Manual", 17-е издание.

Примерами особенно предпочтительных фунгицидов, которые могут быть смешаны с соединением и композицией согласно изобретению, являются:

1) Ингибиторы биосинтеза эргостерола, например, (1.001) ципроконазол, (1.002) дифеноконазол, (1.003) эпоксиконазол, (1.004) фенгексамид, (1.005) фенпропидин, (1.006) фенпропиморф, (1.007) фенпиразамин, (1.008) флуквинконазол, (1.009) флутриафол, (1.010) имазалил, (1.011) имазалил сульфат, (1.012) ипконазол, (1.013) метконазол, (1.014) миклобутанил, (1.015) паклобутразол, (1.016) прохлораз, (1.017) пропиконазол, (1.018) протиоконазол, (1.019) Пиризоксазол, (1.020) спироксамин, (1.021) тебуконазол, (1.022) тетраконазол, (1.023) триадименол, (1.024) тридеморф, (1.025) тритриконазол, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол, (1.028) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.029) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.030) (2R)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.031) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.032) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.033) (2S)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.034) (R)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.035) (S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.036) [3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил}метил)-1H-1,2,4-триазол, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил}метил)-1H-1,2,4-триазол, (1.039) 1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.041) 1-

{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.050) 2-[1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.051) 2-[2-хлор-4-(2,4-дихлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.052) 2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.053) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.054) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пентан-2-ол, (1.055) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.056) 2-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.059) 5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол, (1.060) 5-(аллилсульфанил)-1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.061) 5-(аллилсульфанил)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.062) 5-(аллилсульфанил)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.063) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.064) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформаид,

(1.065) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,3,3-тетрафторпропокси)фенил]сульфанил}-фенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.066) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(пентафторэтоксифенил)сульфанил]фенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.067) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(1,1,2,2-тетрафторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.068) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,2-трифторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.069) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,3,3-тетрафторпропил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.070) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(пентафторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.071) N'-(2,5-диметил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.072) N'-(4-{[3-(дифторметокси)фенил]сульфанил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.073) N'-(4-{3-[(дифторметил)сульфанил]феноксифенил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.074) N'-[5-бром-6-(2,3-дигидро-1H-инден-2-илокси)-2-метилпиридин-3-ил]-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.075) N'-{4-[(4,5-дихлор-1,3-тиазол-2-ил)окси]-2,5-диметилфенил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.076) N'-{5-бром-6-[(1R)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.077) N'-{5-бром-6-[(1S)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.078) N'-{5-бром-6-[(цис-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.079) N'-{5-бром-6-[(транс-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.080) N'-{5-бром-6-[1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.081) Мефентрифлуконазол, (1.082) Ипфентрифлуконазол.

2) Ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II, например, (2.001) бенховиндифлупир, (2.002) биксафен, (2.003) боскалид, (2.004) карбоксин, (2.005) флуопирам, (2.006) флутоланил, (2.007) флуксапироксад, (2.008) фураметпир, (2.009) Изофетамид, (2.010) изопиразам (антиэпимерный энантиомер 1R,4S,9S), (2.011) изопиразам (антиэпимерный энантиомер 1S,4R,9R), (2.012) изопиразам (антиэпимерный рацемат 1RS,4SR,9SR), (2.013) изопиразам (смесь син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и антиэпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), (2.014) изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1R,4S,9R), (2.015) изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1S,4R,9S), (2.016) изопиразам (син-эпимерный рацемат

1RS,4SR,9RS), (2.017) пенфлуфен, (2.018) пентиопирад, (2.019) пидифлуметофен, (2.020) Пиразифлумид, (2.021) седаксан, (2.022) 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.023) 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.024) 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.025) 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)-бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.026) 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамид, (2.027) 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.028) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.029) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.030) 3-(дифторметил)-N-(7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.031) 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.032) 3-(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.033) 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, (2.034) N-(2-циклопентил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.035) N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.036) N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.037) N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.038) N-(5-хлор-2-изопропилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метанонафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метанонафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.041) N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.042) N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.043) N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.044) N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-

циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.045) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.046) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.047) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-метилбензил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.048) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карботиоамид, (2.049) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.050) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.051) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.052) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.053) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-метилбензил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.054) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.055) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (2.056) N-циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид.

3) Ингибиторы дыхательной цепи в комплексе III, например, (3.001) аметоктрадин, (3.002) амисульбром, (3.003) азоксистробин, (3.004) коуметоксистробин, (3.005) коумоксистробин, (3.006) циазофамид, (3.007) димоксистробин, (3.008) эноксастробин, (3.009) фамоксадон, (3.010) фенамидон, (3.011) флуфеноксистробин, (3.012) флуоксастробин, (3.013) ксероксим-метил, (3.014) метоминостробин, (3.015) оризастробин, (3.016) пикоксистробин, (3.017) пиракlostробин, (3.018) пираметостробин, (3.019) пираоксистробин, (3.020) трифлоксистробин, (3.021) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{{(E)-1-фтор-2-фенилвинил]окси}фенил)этилиден]амино}окси]метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилацетамид, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлорфенил)-1Н-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент-3-енамид, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамид, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамид, (3.025)

(3S,6S,7R,8R)-8-бензил-3-[(3-[(изобутирилокси)метокси]-4-метоксипиридин-2-ил}карбонил)амино]-6-метил-4,9-диоксо-1,5-диоксонан-7-ил 2-метилпропаноате, (3.026) 2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамид, (3.027) N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-формамидо-2-гидроксибензамид, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлор-2-фторфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент-3-енамид, (3.029) метил {5-[3-(2,4-диметилфенил)-1H-пиразол-1-ил]-2-метилбензил}карбамат.

4) Ингибиторы митоза и клеточного деления, например, (4.001) карбендазим, (4.002) диэтофенкарб, (4.003) этабоксам, (4.004) флуопиколид, (4.005) пенцикурон, (4.006) тиабендазол, (4.007) тиофанат-метил, (4.008) зоксамид, (4.009) 3-хлор-4-(2,6-дифторфенил)-6-метил-5-фенилпиридазин, (4.010) 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-6-метилпиридазин, (4.011) 3-хлор-5-(6-хлорпиридин-3-ил)-6-метил-4-(2,4,6-трифторфенил)пиридазин, (4.012) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.013) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.014) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бромфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.015) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.016) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.017) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.018) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.019) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.020) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.021) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.022) 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторфенил)-3,6-диметилпиридазин, (4.023) N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.024) N-(2-бромфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.025) N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин.

5) Соединения, способные оказывать многонаправленное действие, например, (5.001) бордоская смесь, (5.002) каптафол, (5.003) каптан, (5.004) хлорталонил, (5.005) гидроксид меди, (5.006) нафтенат меди, (5.007) оксид меди, (5.008) оксихлорид меди, (5.009) сульфат меди(2+), (5.010) дитианон, (5.011) додин,

(5.012) фолпет, (5.013) манкоцеб, (5.014) манеб, (5.015) метирам, (5.016) метирам цинк, (5.017) оксинат меди, (5.018) пропинеб, (5.019) сера и препараты серы, включая полисульфид кальция, (5.020) тирам, (5.021) цинеб, (5.022) цирам, (5.023) 6-этил-5,7-диоксо-6,7-дигидро-5Н-пирроло[3',4':5,6][1,4]дитиино[2,3-с][1,2]тиазол-3-карбонитрил.

6) Соединения, способные включать иммунологические защитные механизмы, например, (6.001) ацибензолар-S-метил, (6.002) изотианил, (6.003) пробеназол, (6.004) тиадинил.

7) Ингибиторы биосинтеза аминокислоты и/или белка, например, (7.001) ципродинил, (7.002) касугамицин, (7.003) касугамицин гидрохлорид гидрат, (7.004) окситетрациклин, (7.005) пириметанил, (7.006) 3-(5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолон.

8) Ингибиторы продуцирования АТФ, например, (8.001) силтиофам.

9) Ингибиторы синтеза клеточной стенки, например, (9.001) бентиаваликарб, (9.002) диметоморф, (9.003) флуморф, (9.004) ипроваликарб, (9.005) мандипропамид, (9.006) пириморф, (9.007) валифеналат, (9.008) (2E)-3-(4-трет-бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-он, (9.009) (2Z)-3-(4-трет-бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-он.

10) Ингибиторы синтеза липидов и мембранного синтеза, например, (10.001) пропамокарб, (10.002) пропамокарб гидрохлорид, (10.003) толклофос-метил.

11) Ингибиторы биосинтеза меланина, например, (11.001) трициклазол, (11.002) 2,2,2-трифторэтил {3-метил-1-[(4-метилбензоил)амино]бутан-2-ил}карбамат.

12) Ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот, например, (12.001) беналаксил, (12.002) беналаксил-М (киралаксил), (12.003) металаксил, (12.004) металаксил-М (мефеноксам).

13) Ингибиторы сигнальной трансдукции, например, (13.001) флудиоксонил, (13.002) ипродион, (13.003) процимидон, (13.004) проквиназид, (13.005) хиноксифен, (13.006) винклозолин.

14) Соединения, способные действовать в качестве разобщающих агентов, например, (14.001) флуазинам, (14.002) мептилдинокап.

15) Дополнительные соединения, например, (15.001) абсцизовая кислота, (15.002) бентиазол, (15.003) бетоксазин, (15.004) капсимицин, (15.005) карвон, (15.006) хинометионт, (15.007) куфранеб, (15.008) цифлуфенамид, (15.009) цимоксанил, (15.010) ципросульфамид, (15.011) флутианил, (15.012) фосетил-алюминий, (15.013) фосетил-кальций, (15.014) фосетил-натрий, (15.015) метил изотиоцианат, (15.016) метрафенон, (15.017) милдиомицин, (15.018) натамицин, (15.019) никель диметилдитиокарбамат, (15.020) нитротал-изопропил, (15.021) оксамокарб, (15.022) оксатиापипронил, (15.023) оксифентиин, (15.024) пентахлорфенол и соли, (15.025) фосфорная кислота и ее соли, (15.026) пропамокарб-фосетилат, (15.027) пириофенон (хлазафенон), (15.028) тебуфлоквин, (15.029) теклофталам, (15.030) толнифанид, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]этанон, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]этанон, (15.033) 2-(6-бензилпиперидин-2-ил)хиназолин, (15.034) 2,6-диметил-1H,5H-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2H,6H)-тетрон, (15.035) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанон, (15.036) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-хлор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанон, (15.037) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-фтор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанон, (15.038) 2-[6-(3-фтор-4-метоксифенил)-5-метилпиперидин-2-ил]хиназолин, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфонат, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфонат, (15.041) 2-{2-[(7,8-дифтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]-6-фторфенил}пропан-2-ол, (15.042) 2-{2-фтор-6-[(8-фтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]фенил}пропан-2-ол, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-

4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфонат, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}фенил метансульфонат, (15.045) 2-фенилфенол и соли, (15.046) 3-(4,4,5-трифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолин, (15.047) 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолин, (15.048) 4-амино-5-фторпиримидин-2-ол (таутомерная форма 4-амино-5-фторпиримидин-2(1H)-он), (15.049) 4-оксо-4-[(2-фенилэтил)амино]бутановая кислота, (15.050) 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиол, (15.051) 5-хлор-N'-фенил-N'-(проп-2-ин-1-ил)тиофен-2-сульфоногидразид, (15.052) 5-фтор-2-[(4-фторбензил)окси]пиримидин-4-амин, (15.053) 5-фтор-2-[(4-метилбензил)окси]пиримидин-4-амин, (15.054) 9-фтор-2,2-диметил-5-(хинолин-3-ил)-2,3-дигидро-1,4-бензоксазепин, (15.055) бут-3-ин-1-ил {6-[[{(Z)-(1-метил-1H-тетразол-5-ил)(фенил)метилен]амино}окси]метил]пиридин-2-ил}карбамат, (15.056) этил (2Z)-3-амино-2-циано-3-фенилакрилат, (15.057) феназин-1-карбоновая кислота, (15.058) пропил 3,4,5-тригидроксибензоат, (15.059) хинолин-8-ол, (15.060) хинолин-8-ол сульфат (2:1), (15.061) трет-бутил {6-[[{(1-метил-1H-тетразол-5-ил)(фенил)метилен]амино}окси]метил]пиридин-2-ил}карбамат, (15.062) 5-фтор-4-имино-3-метил-1-[(4-метилфенил)сульфонил]-3,4-дигидропиримидин-2(1H)-он.

Все указанные вещества для использования в смеси классов (1) – (15) в соответствии с описанием в настоящем документе выше могут присутствовать в виде свободного соединения и/или в виде агрономически приемлемых солей, если их функциональные группы позволяют это.

В тех случаях, когда соединение (A) или соединение (B) могут присутствовать в таутомерных формах, такое соединение при упоминании по тексту настоящего документа также включает, в соответствующих случаях, соответствующие таутомерные формы, даже если они не упомянуты отдельно.

Активные ингредиенты, общепринятое наименование которых указано в настоящем документе, являются известными и описаны, например, в справочнике "The Pesticide Manual" (16-е изд., British Crop Protection Council (Британский совет по защите растений)), кроме того, их поиск может осуществляться в интернете (например, по адресу www.alanwood.net/pesticides).

Способы и области применения

Соединение и композиция согласно изобретению обладают высокой микробицидной активностью. Они могут быть использованы для борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как нежелательные фитопатогенные грибы и бактерии. Они могут быть особенно эффективно использованы для защиты растений (для борьбы с микроорганизмами, вызывающими заболевания растений) или для защиты материалов (например, промышленных материалов, древесины, товаров при хранении), как более подробно описано ниже. В частности, соединение и композиция согласно изобретению также могут быть использованы для защиты семян, прорастающих растений, рассады, растений, частей растений, плодов и почвы, на которой произрастают растения, от нежелательных микроорганизмов, в частности, от фитопатогенных грибов.

При использовании по тексту настоящего документа термин "борьба" включает профилактическую обработку от нежелательных микроорганизмов, а также обработку для лечения от нежелательных микроорганизмов. Нежелательными микроорганизмами могут быть патогенные бактерии или патогенные грибы, в частности, фитопатогенные бактерии или фитопатогенные грибы. Как подробно описано ниже, эти фитопатогенные микроорганизмы являются возбудителями широкого спектра заболеваний растений.

В частности, соединение и композиция согласно изобретению также могут быть использованы в качестве фунгицидов. В частности, они могут быть использованы для защиты растений, например, для борьбы с нежелательными грибами, такими как плазмодиофоромицеты, оомицеты, хитридиомицеты, зигомицеты, аскомицеты, базидиомицеты и дейтеромицеты.

Соединение и композиция согласно изобретению также могут быть использованы в качестве бактерицида. В частности, они могут быть использованы для защиты растений, например, для борьбы с нежелательными бактериями, такими как бактерии семейств Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae и Streptomycetaceae.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как нежелательные грибы и бактерии, в частности, с фитопатогенными грибами, включающему этап обработки

микроорганизмов и/или места их обитания (обработки растений, частей растений, семян, плодов или почвы, в которой растения произрастают), по меньшей мере, одним соединением согласно изобретению или, по меньшей мере, одной композицией согласно изобретению.

Как правило, когда соединение и композицию согласно изобретению используют для лечебной или профилактической борьбы с фитопатогенными грибами, растения, части растения, плоды, семена или почва, на которой произрастают растения, обрабатывают эффективным и нефитотоксичным количеством соединения согласно изобретению или композиции согласно изобретению.

Выражение "эффективное нефитотоксичное количество" означает такое количество, которое достаточно эффективно для борьбы с грибковым заболеванием культуры или для полного устранения грибкового заболевания, и которое при этом не вызывает каких бы то ни было заметных симптомов фитотоксичности. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне, в зависимости от того, от какого вида грибка осуществляют защиту, от вида культуры, от климатических условий и от соответствующего используемого соединения или от композиции согласно изобретению. Такое количество может быть определено с помощью систематических полевых испытаний, известных специалистам.

Растение и части растений

Соединением и композицией согласно изобретению могут обрабатываться любые растения или любые части растения.

Термин "растения" включает все растения и популяции растений, такие как желательные и нежелательные дикорастущие растения или сельскохозяйственные культуры (включая свободнорастущие сельскохозяйственные культуры). К сельскохозяйственным культурам, соответственно, могут относиться растения, которые могут быть получены путем обычного разведения растений и способов оптимизации, или способами биотехнологии и геной инженерии, или путем сочетания данных методов, включая генетически модифицированные растения (ГМО или трансгенные растения) и их сорта, которые могут быть защищены и не защищены правами растениеводов-селекционеров.

Генетически модифицированные растения (ГМО)

Генетически модифицированными растениями (ГМО или трансгенными растениями) являются растения, у которых в геноме устойчиво встроен гетерологичный ген. Выражение "гетерологичный ген", по существу, означает ген, который создан или собран вне растения, и который, при введении в ядерный, хлоропластный или митохондриальный геном, дает трансформированное растение с новыми или улучшенными агротехническими или другими свойствами, за счет экспрессии целевого белка или полипептида, или за счет отрицательной регуляции или сайленсинга другого (других) гена (генов), которые присутствуют в растении (с использованием, например, антисмысловой технологии, косупрессорной технологии или технологии РНК-интерференции (RNAi) или технологии микроРНК (miRNA)). Гетерологичный ген, который локализован в геноме, также называется трансгеном. Трансген, который определен конкретной локализацией в геноме растения, называют трансформационным или трансгенным объектом.

Под термином "сорта растений" подразумевают растения, обладающие новыми свойствами ("характеристиками"), которые были получены методами обычного разведения, мутагенезом или с применением технологии рекомбинантных ДНК. Это могут быть сорта, разновидности, био- или генотипы.

Под частями растения понимают все части и органы растения, которые располагаются над и под землей, такие как побеги, листья, иглы, цветоножки, стебли, цветки, плодовые тела, плоды, семена, корни, клубни и корневища. К частям растений также относится собираемый урожай и материал для растительного и генеративного размножения, например, черенки, клубни, корневища, побеги и семена.

Растения, которые могут быть обработаны в соответствии с настоящим изобретением включают следующие: хлопок, лен, виноград, фрукты, овощи, такие как *Rosaceae sp.* (например, семечковые плоды, такие как яблоки и груши, но также и косточковые плоды, такие как абрикосы, вишни, миндальные орехи и персики, а также бескосточковые ягоды, такие как клубника), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (например, банановые деревья и плантации), *Rubiaceae sp.* (например, кофе), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae*

sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфруты); *Solanaceae sp.* (например, помидоры), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (например, салат-латук), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (например, огурец), *Alliaceae sp.* (например, лук-порей, лук), *Papilionaceae sp.* (например, горох); основные сельскохозяйственные культуры, такие как *Gramineae sp.* (например, маис, дерновые культуры, злаки, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), *Asteraceae sp.* (например, подсолнук), *Brassicaceae sp.* (например, белокочанная капуста, краснокочанная капуста, брокколи, цветная капуста, брюссельская капуста, китайская капуста, кольраби, редис и масличный рапс, горчица, хрен и кресс-салат), *Fabaceae sp.* (например, бобы, арахис), *Papilionaceae sp.* (например, соя), *Solanaceae sp.* (например, картофель), *Chenopodiaceae sp.* (например, сахарная свекла, кормовая свекла, листовая свекла, свекла); полезные и декоративные растения для садов и лесопосадок; а также генетически модифицированные разновидности данных растений.

Патогены

Примеры патогенов грибковых заболеваний, которые могут подвергаться обработке согласно изобретению, помимо прочего, включают:

заболевания, вызванные возбудителями мучнистой росы, например, видами *Blumeria*, например, *Blumeria graminis*; видами *Podosphaera*, например, *Podosphaera leucotricha*; видами *Sphaerotheca*, например, *Sphaerotheca fuliginea*; видами *Uncinula*, например, *Uncinula necator*;

заболевания, вызванные возбудителями ржавчинных заболеваний, например, видами *Gymnosporangium*, например, *Gymnosporangium sabinae*; видами *Hemileia*, например, *Hemileia vastatrix*; видами *Phakopsora*, например, *Phakopsora pachyrhizi* или *Phakopsora meibomia*; видами *Puccinia*, например, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* или *Puccinia striiformis*; видами *Uromyces*, например, *Uromyces appendiculatus*;

заболевания, вызванные возбудителями из группы оомицетов, например, видами *Albugo*, например, *Albugo candida*; видами *Bremia*, например, *Bremia lactucae*; видами *Peronospora*, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora infestans*; видами *Plasmopara*, например,

Plasmopara viticola; видами *Pseudoperonospora*, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*;

заболевания пятнистости и увядания листьев, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria solani*; видами *Cercospora*, например, *Cercospora beticola*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cucumerinum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (кондиальная форма: *Drechslera*, син: *Helminthosporium*) или *Cochliobolus miyabeanus*; видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum lindemuthanium*; видами *Cycloconium*, например, *Cycloconium oleaginum*; видами *Diaporthe*, например, *Diaporthe citri*; видами *Elsinoe*, например, *Elsinoe fawcettii*; видами *Gloeosporium*, например, *Gloeosporium laeticolor*; видами *Glomerella*, например, *Glomerella cingulata*; видами *Guignardia*, например, *Guignardia bidwelli*; видами *Leptosphaeria*, например, *Leptosphaeria maculans*; видами *Magnaporthe*, например, *Magnaporthe grisea*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Mycosphaerella*, например, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* или *Mycosphaerella fijiensis*; видами *Phaeosphaeria*, например, *Phaeosphaeria nodorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora tritici repentis*; видами *Ramularia*, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*; видами *Rhynchosporium*, например, *Rhynchosporium secalis*; видами *Septoria*, например, *Septoria apii* или *Septoria lycopersici*; видами *Stagonospora*, например, *Stagonospora nodorum*; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Venturia*, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корня и стебля, вызванные, например, видами *Corticium*, например, *Corticium graminearum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium oxysporum*; видами *Gaeumannomyces*, например, *Gaeumannomyces graminis*; видами *Plasmodiophora*, например, *Plasmodiophora brassicae*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Sarocladium*, например, *Sarocladium oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium oryzae*; видами *Tapesia*, например, *Tapesia aciformis*; видами *Thielaviopsis*, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания колоса и метелки (включая початки кукурузы)), вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria* spp.; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cladosporioides*; видами *Claviceps*, например, *Claviceps purpurea*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами

Monographella, например, *Monographella nivalis*; видами *Stagnospora*, например, *Stagnospora nodorum*;

заболевания, вызванные головневыми грибами, например, видами *Sphacelotheca*, например, *Sphacelotheca reiliana*; видами *Tilletia*, например, *Tilletia caries* или *Tilletia controversa*; видами *Urocystis*, например, *Urocystis occulta*; видами *Ustilago*, например, *Ustilago nuda*;

заболевания гнили плодов, вызванные, например, видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum* или *Penicillium purpurogenum*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus stolonifer*; видами *Sclerotinia*, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium albo-atrum*;

заболевания гнили и увядания, передающиеся с семенами и через почву, а также заболевания сеянцев, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria brassicicola*; видами *Aphanomyces*, например, *Aphanomyces euteiches*; видами *Ascochyta*, например, *Ascochyta lentis*; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium herbarum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (кондиальная форма: *Drechslera*, *Bipolaris* Син: *Helminthosporium*); видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum coccodes*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Macrophomina*, например, *Macrophomina phaseolina*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum*; видами *Phoma*, например, *Phoma lingam*; видами *Phomopsis*, например, *Phomopsis sojae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora cactorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora graminea*; видами *Pyricularia*, например, *Pyricularia oryzae*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium rolfsii*; видами *Septoria*, например, *Septoria nodorum*; *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Verticillium*, например, видами *Verticillium dahliae*;

раковые заболевания, заболевания, вызванные галловыми нематодами, и ведьмина метла, вызванные, например, видами *Nectria*, например, *Nectria galligena*;

фузариозное увядание, вызванные, например, видами *Monilinia*, например, *Monilinia laxa*;

деформации листьев, цветов и плодов, вызванные, например, видами *Exobasidium*, например, *Exobasidium vexans*; видами *Taphrina*, например, *Taphrina deformans*;

дегенеративные заболевания древесных растений, вызванные, например, видами *Esca*, например, *Phaeoconiella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* или *Fomitiporia mediterranea*; видами *Ganoderma*, например, *Ganoderma boninense*;

заболевания цветов и семян, вызванные, например, видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*;

заболевания клубней растений, вызванные, например, видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Helminthosporium*, например, *Helminthosporium solani*;

заболевания, вызванные бактериальными патогенами, например, видами *Xanthomonas*, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами *Pseudomonas*, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами *Erwinia*, например, *Erwinia amylovora*.

заболевания сои:

грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, например, пятнистость листьев, вызываемая видами *Alternaria* (*Alternaria* spec. *atrans tenuissima*), антракноз (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), ржавая пятнистость (*Septoria glycines*), церкоспороз (*Cercospora kikuchii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами хоанефора (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), пятнистость листьев, вызываемая грибами дактулиофора (*Dactuliophora glycines*), ложная мучнистая роса (*Peronospora manshurica*), увядание, вызываемое грибами рода дрекслера (*Drechslera glycini*), церкоспороз сои (*Cercospora sojae*), пятнистость листьев, вызываемая грибами лептосферулина (*Leptosphaerulina trifolii*), пятнистость листьев, вызываемая грибами филлостикта (*Phyllosticta sojaecola*), ожог бобов и стеблей сои (*Phomopsis sojae*), настоящая мучнистая роса (*Microsphaera diffusa*), пятнистость листьев, вызываемая грибами рода пиренохета (*Pyrenochaeta glycines*), ризоктониоз (*Rhizoctonia solani*), ржавчина (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), парша (*Sphaceloma glycines*),

увядание листьев, вызываемое грибами рода стемфилиум (*Stemphylium botryosum*), коринеспорозная пятнистость мишеневидная пятнистость листьев (*Corynespora cassiicola*).

Грибковые заболевания корней и оснований стебля, например, черная корневая гниль (*Calonectria crotalariae*), угольная гниль (*Macrophomina phaseolina*), фузариоз или фузариозный вилт, корневая гниль и гниль стручка и корневой шейки (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), гниение корней, вызываемое видами миколептодискус (*Mycoleptodiscus terrestris*), неocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), гниль бобов и стеблей (*Diaporthe phaseolorum*), стеблевый рак (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фитофтороз (*Phytophthora megasperma*), бурая гниль стеблей сои (*Phialophora gregata*), грибная гниль (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), ризоктониоз, войлочная болезнь и выпревание (*Rhizoctonia solani*), склеротиниоз (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероциальная южная гниль (*Sclerotinia rolfsii*), гниение корней, вызываемое видами тиелавиопсис (*Thielaviopsis basicola*).

Микотоксины

Кроме того, соединение и композиция согласно изобретению могут снизить содержание микотоксинов в собранном материале и в полученных из него пищевых продуктах и кормах. В частности, микотоксины включают, помимо прочего, следующие вещества: дезоксиниваленол (DON), ниваленол, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, Т2- и НТ2-токсин, фумонизины, зеараленон, монилиформин, фузарин, диацетооксисцирпенол (DAS), боверицин, энниатин, фузаропротрофериин, фузаренол, охратоксин, патулин, алкалоиды спорыньи и афлатоксины, которые могут производиться, например, следующими грибами: видами *Fusarium*, такими как *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoroii*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides* и т.д., а также видами *Aspergillus*, такими как *A. flavus*, *A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, видами *Penicillium*, такими как *P. verrucosum*, *P. viridicatum*, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P.*

claviforme, *P. roqueforti*, видами *Claviceps*, такими как *C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, видами *Stachybotrys* и другими.

Защита материалов

Соединение и композиция согласно изобретению могут быть также использованы для защиты материалов, для защиты промышленных материалов от воздействия фитопатогенных грибов и разрушения фитопатогенными грибами.

Кроме того, соединение и композиция согласно изобретению могут быть использованы в качестве композиций, предохраняющих от биологического обрастания, в отдельности или комбинации с другими активными ингредиентами.

В контексте настоящего изобретения под термином "промышленные материалы" подразумевают неживые материалы, которые предназначены для применения в промышленности. Например, промышленными материалами, защита которых может осуществляться от изменений или разрушения вследствие воздействия микроорганизмов, могут являться клеящие вещества, клеи, бумага, обои и доски/картон, текстильные материалы, ковры, кожа, древесина, волокнистая масса и ткани, краска и изделия из пластика, смазывающе-охлаждающие жидкости, и другие материалы, которые могут поражаться или разрушаться микроорганизмами. Также в составе материалов, защита которых может осуществляться согласно изобретению, можно упомянуть части производственных установок и зданий, например, контуры циркуляции охлаждающей воды, системы охлаждения и нагрева, а также блоки вентиляции и кондиционирования воздуха, которые могут разрушаться вследствие развития микроорганизмов. Промышленные материалы по настоящему изобретению предпочтительно включают клеящие вещества, клеи, бумагу и картон, кожу, древесину, краску, смазывающе-охлаждающие жидкости и теплообменные жидкости, более предпочтительно, древесину.

Соединения формулы (I) могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

В случае обработки древесины соединение и композиция согласно изобретению могут также быть использованы против грибковых заболеваний, которые могут развиваться на поверхности или внутри лесоматериалов.

Термин "лесоматериалы" означает все виды пород дерева и все виды обработанной древесины, предназначенные для строительства, например, цельная древесина, древесина высокой плотности, ламинированная древесина и фанера. Кроме того, соединение и композиция согласно изобретению могут быть использованы для защиты от биологического обрастания объектов, которые контактируют с минерализованной или соленой водой, в частности, корпусов судов, экранов, сетей, строений, мест стоянки и сигнальных систем.

Соединение и композиция согласно изобретению могут быть также использованы для защиты продукции при хранении. "Товары для хранения" означают природные вещества растительного или животного происхождения и полученные путем их переработки продукты, природного происхождения, для которых необходима долгосрочная защита. Товары для хранения растительного происхождения включают, например, растения или их части, такие как стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерно, могут быть защищены в свежесобранном состоянии или в переработанном виде, например, путем предварительного высушивания, увлажнения, измельчения, перемалывания, спрессовывания или высокотемпературной обработки. Товары для хранения также включают лесоматериалы, как сырые лесоматериалы, такие как строительные лесоматериалы, опоры линии электропередачи и ограждения, так и лесоматериалы в виде готовых изделий, такие как мебель. Товарами для хранения животного происхождения являются, например, шкуры, кожа, меховые изделия и изделия из волосяной ткани меха. Композиции согласно изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

Микроорганизмы, которые способны портить промышленные материалы или изменять их свойства, включают, например, бактерии, грибы, дрожжи, водоросли и организмы, живущие в иле. Соединения формулы (I) предпочтительно обладают воздействием на грибы, в особенности, на плесень, на грибы в результате воздействия которых происходит обесцвечивание или разрушение древесины (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* и *Zygomycetes*), а также воздействием на организмы, живущие в иле, и водоросли. Примеры таких организмов включают микроорганизмы следующих родов: *Alternaria*, такие как *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, такие как *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, такие как *Chaetomium*

globosum; *Coniophora*, такие как *Coniophora puetana*; *Lentinus*, такие как *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, такие как *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, такие как *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, такие как *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, такие как *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, такие как *Trichoderma viride*; *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* и *Tyromyces spp.*, *Cladosporium spp.*, *Paecilomyces spp.* *Mucor spp.*, *Escherichia*, такие как *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, такие как *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, такие как *Staphylococcus aureus*, *Candida spp.* и *Saccharomyces spp.*, такие как *Saccharomyces cerevisiae*.

Обработка семян

Соединение и композиция согласно изобретению также могут быть использованы для защиты семян от нежелательных микроорганизмов, таких как фитопатогенные микроорганизмы, например, от фитопатогенных грибов. При использовании по тексту настоящего документа термин "семена" включает семена в состоянии покоя, подготовленные семена, предварительно проросшие семена и семена с появившимися корнями и листьями.

Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян от нежелательных микроорганизмов, в частности, от нежелательных фитопатогенных грибов, который включает этап обработки семян соединением или композицией согласно изобретению.

Обработка семян соединением или композицией согласно изобретению защищает семена от фитопатогенных микроорганизмов, а также защищает прорастающие растения, рассаду и растения после того, как они проросли из обработанных семян. Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян, прорастающих растений и рассады.

Обработка семян может осуществляться до засева, во время засева и сразу после него.

Когда обработка семян производится до засева (например, в виде так называемого нанесения на семена), она может выполняться следующим образом: семена могут быть помещены в смешивающее устройство вместе с необходимым количеством соединения или композиции согласно изобретению, семена и

соединение или композиция согласно изобретению смешивают до однородного распределения соединения или композиции на семенах. при необходимости, семена могут затем быть высушены.

Изобретение также относится к семенам, обработанным соединением или композицией согласно изобретению.

Предпочтительно, чтобы семена были достаточно твердыми, чтобы не допустить повреждений во время обработки. Обычно обработка семян производится в любое время между сбором урожая и посевом и сразу после посева. Обычно используют семена, которые были отделены от растения и у которых были удалены стержни початка, шелуха, плодоножки, оболочки, волоски или мякоть плода. Например, можно использовать семена, которые были собраны, очищены и высушены так, чтобы содержание влаги составляло менее 15 мас.%. В качестве альтернативы, также можно использовать семена, которые после высушивания, например, были обработаны водой, а затем снова высушены, или же семена сразу после их примирования, семена, которые хранятся в примированном состоянии, или предварительно проросшие семена, или же семена, высеянные на брудерных лотках, пленке или бумаге.

Количество соединения или композиции согласно изобретению, наносимое на семена, как правило, таково, чтобы не навредить процессу прорастания семян и самому растению. Это следует обеспечить, в особенности, в случае использования соединения согласно изобретению, которое может иметь фитотоксичное воздействие при определенных дозировках. Чтобы обеспечить оптимальную защиту семян и прорастающих растений с минимальным расходом используемого соединения, необходимо также принимать во внимание естественные фенотипы трансгенных растений при определении количества соединения согласно изобретению, которым обрабатывают семена.

Соединение формулы может наноситься непосредственно на семена само по себе, т.е. без использования каких-либо других компонентов, без разбавления. Соединением согласно изобретению также могут обрабатываться семена.

Соединение и композиция согласно изобретению могут быть использованы для защиты семян любых сортов растений. Предпочтительно обрабатывают семена злаковых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, просо, тритикале и овес),

масличного рапса, кукурузы, хлопка, сои, риса, картофеля, подсолнечника, бобов, кофе, гороха, свеклы (например, сахарной свеклы и кормовой свеклы), арахиса, овощей (таких как помидор, огурец, лук и салат-латук), дерновых и декоративных культур. Более предпочтительно обрабатывают семена пшеницы, сои, масличного рапса, кукурузы и риса.

Соединение и композиция согласно изобретению могут быть использованы для обработки трансгенных семян, в частности, семян растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, в результате чего защитный эффект усиливается. Семена растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, могут содержать, по меньшей мере, один гетерологический ген, который обеспечивает экспрессию указанного полипептида или белка. В трансгенных семенах такие гетерологические гены могут происходить, например, из микроорганизмов, таких родов как *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Такие гетерологические гены предпочтительно происходят из рода *Bacillus*, в этом случае генный продукт обладает эффективностью в отношении огневки кукурузной и/или западный кукурузный жук. Особенно предпочтительны гетерологические гены, происходящие из *Bacillus thuringiensis*.

Вид обработки

Соединение согласно изобретению может применяться в отдельности или, например, в форме готовых растворов, эмульсий, суспензий на водной или масляной основе, порошков, смачиваемых порошков, паст, растворимых порошков, пылевидных препаратов, растворимых гранул, гранул для разбросного внесения, концентратов суспензии, в виде натуральных продуктов, пропитанных соединением согласно изобретению, синтетических веществ, пропитанных соединением согласно изобретению, удобрений, а также микрокапсуляций в полимерном веществе.

Применение осуществляют обычным способом, например, путем полива, распыления, мелкодисперсного разбрызгивания, разбросного внесения, внесения с пеной, распределения на площади посева и аналогичными способами. Также

соединение согласно изобретению можно применять методом внесения ультра-малых объемов (УМО) или впрыскивать соединение согласно изобретению в почву.

Эффективное нефитотоксичное количество соединения согласно изобретению, которым обрабатывают растения, части растения, плоды, семена или почва, будет зависеть от различных факторов, например, от конкретного используемого соединения/композиции, от того, подвергаются ли обработке все растение или часть растения или плод растения, семена или почва), от типа обработки (опрыскивание, распыление, протравливание семян), от цели обработки (лечебная или профилактическая) и от типа микроорганизмов.

При использовании соединения согласно изобретению в качестве фунгицида дозировки могут варьироваться в сравнительно широком диапазоне, в зависимости от способа внесения или применения. В случае обработки частей растения, например, листьев, дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 10 - 1000 г/га, более предпочтительно 50 - 300 г/га (в случае обработки путем поливки или орошения, возможно еще более снизить дозировку, в особенности, если используют инертные субстраты, такие как минеральная вата или перлит). В случае обработки семян дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 200 г на 100 кг семян, предпочтительно в диапазоне 1 - 150 г на 100 кг семян, более предпочтительно 2,5 - 25 г на 100 кг семян, еще более предпочтительно 2,5 - 12,5 г на 100 кг семян; В случае обработки почвы дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 1 - 5000 г/га.

Указанные дозировки приведены в качестве примера и не предусматривают ограничение области применения настоящего изобретения.

Таким образом, соединения формулы (I) могут быть использованы для защиты растений от атаки указанных патогенов в течение определенного периода времени после обработки. Период, в течение которого обеспечивается защита, как правило, имеет продолжительность 1 - 28 дней, предпочтительно 1 - 14 дней, более предпочтительно 1 - 10 дней, наиболее предпочтительно 1 - 7 дней после обработки растений соединениями формулы (I), или до 200 дней после обработки семян.

В частности, обработке соединениями формулы (I) в соответствии с изобретением могут подвергаться растения, перечисленные в настоящем документе. Вышеуказанные предпочтительные диапазоны для соединений формулы (I) также относятся к обработке этих растений. Особое внимание уделяют обработке растений комбинациями активных соединений или композициями, специально указанными в тексте настоящего документа.

Противогрибковое действие

В дополнение, соединение и композиция согласно изобретению также обладают превосходным противогрибковым действием. Они обладают чрезвычайно широким спектром противогрибкового действия, в особенности воздействием на дерматофиты и дрожжевые грибы, плесень и двухфазные грибы (например, на виды *Candida*, например, *Candida albicans*, *Candida glabrata*), и *Epidermophyton floccosum*, виды *Aspergillus*, например, *Aspergillus niger* и *Aspergillus fumigatus*, виды *Trichophyton*, например, *Trichophyton mentagrophytes*, виды *Microsporon*, например, *Microsporon canis* и *Microsporon audouinii*. Данный перечень этих грибов ни в коем случае не представляет собой ограничение спектра противогрибкового действия, а носит лишь характер пояснения.

Соединение и композиция согласно изобретению могут быть использованы также для борьбы с важными патогенными грибами в рыбоводстве и при разведении ракообразных, например, для борьбы с *saprolegnia diclina* у форели и *saprolegnia parasitica* у речного рака.

Таким образом, соединение и композиция согласно изобретению могут применяться как в области медицины, так и в других областях.

Регуляция роста растений

В некоторых случаях, соединение и композиция согласно изобретению, при определенной концентрации или дозировке, могут также применяться в качестве регуляторов роста или агентов, улучшающих характеристики растений, или в качестве микробицидов, например, фунгицидов, противогрибковых средств, бактерицидов, вирицидов (включая композиции против виридов) или в качестве композиций против микоплазмоподобных организмов (MLO) и риккетсииподобных организмов (RLO).

Соединение и композиция согласно изобретению участвуют в физиологических процессах у растений и, следовательно, также могут быть использованы в качестве регуляторов роста. Использование регуляторов роста может иметь различное воздействие на растения. Воздействие таких веществ в значительной степени зависит от времени применения относительно стадии развития растения, а также от количеств активного ингредиента, которым обрабатывают растения, или который вносится в среду произрастания растений, а также от вида обработки или внесения. В каждом случае, регуляторы роста должны обладать определенным целевым воздействием на сельскохозяйственные культуры.

Регулирующие воздействия на рост включают более раннее прорастание, улучшенную всхожесть, более развитую корневую систему и/или улучшенный рост корней, улучшенную способность побегообразования, более продуктивные побеги, более раннее цветение, увеличенную высоту и/или биомассу растения, укороченные стебли, улучшенный рост побегов, количество зерен на колос, количество колосьев на м², количество столонов и/или количество цветков, улучшенный индекс урожайности, больший размер листьев, меньшее количество мертвых базальных листьев, улучшенное листорасположение, более раннее вызревание/более раннее плодоношение, однородное вызревание, повышенная продолжительность периода налива зерна, улучшенное вызревание плодов, увеличенный размер плодов/овощей, устойчивость при прорастании и сниженное полежание.

Термин "повышенная урожайность" или "улучшенная урожайность" относится к общей биомассе на гектар, выходу продукта в расчете на гектар, отношению веса косточки/фрукта, размеру семян и/или весу гектолитра, а также к улучшенному качеству продукции, включая следующие характеристики:

улучшенная пригодность для переработки в отношении распределения по размерам (зерен, плодов и т.д.), однородное вызревание, влагосодержание зерна, улучшенные характеристики при помоле, улучшенные характеристики при винификации, улучшенные характеристики при варении пива, повышенный выход сока, улучшенные характеристики при сборе урожая, перевариваемость, число седиментации, число падения, стабильность стручков, стабильность при хранении, улучшенная длина/прочность/однородность волокон, повышенное качество

молока и/или мяса у животных, кормление которых происходит с использованием силоса, адаптация при кулинарном приготовлении и жарке;

также включая улучшенные товарные качества в отношении улучшенного качества плодов/зерна, распределение по размерам (зерен, плодов и т.д.), большая продолжительность срока хранения/срока сохраняемости, твердость/мягкость, вкус (запах, консистенция и т.д.), сортность (размер, форма, количество ягод и т.д.), количество ягод/плодов на грозди, хрусткость, свежесть, покрытие воском, частота физиологических нарушений, цвет и т.д.;

также включая повышенное содержание целевых ингредиентов, например, содержание белков, жирных кислот, содержание масел, качество масел, аминокислотный состав, содержание сахаров, содержание кислот (рН), отношение сахара/кислоты (Brix), полифенолы, содержание крахмала, пищевая ценность, содержание глютена/клейковинность, энергосодержание, вкусовые качества и т.д.;

также включая пониженное содержание нежелательных ингредиентов, например, меньшее содержание микотоксинов, меньшее содержание афлатоксинов, уровень геосмина, содержание ароматических и фенольных компонентов, лакказы, полифенол оксидазы и пероксидазы, содержание нитратов и т.д.

Соединения-регуляторы роста растений могут быть использованы, например, для замедления вегетативного развития растений. Такое подавление развития представляет экономический интерес, например, для дерновых культур, так как таким образом возможно уменьшить частоту кошения травы в декоративных садах, парках и спортивных площадках, на обочине дорог, в аэропортах или на площадях с фруктовыми культурами. Также подавление развития важно для травянистых и древесных растений, выращиваемых на обочинах дорог, вблизи трубопроводов или воздушных линий или, в целом, в таких местах, где нежелателен бурный рост растений.

Также, важное значение имеет применение регуляторов роста для подавления продольного роста злаковых культур. Это снижает или полностью устраняет опасность полегания растений до урожая. В дополнение, при использовании регуляторов роста может происходить укрепление стеблей злаков, что также снижает риск полегания. При использовании регуляторов роста для

укрепления и укорочения стеблей злаков обеспечивается возможность внесения больших объемов удобрений для увеличения урожая без опасности полегания.

Для многих сельскохозяйственных культур подавление вегетативного развития растений обеспечивает возможность посадки растений с большей плотностью, таким образом, на одинаковой площади может быть получен больший урожай. Еще одним преимуществом меньших растений, полученных таким образом, является то, что таким образом проще культивировать растения и собирать урожай.

При снижении вегетативного развития растений можно также добиться увеличения или улучшения урожая, так как в этом случае обеспечивается более эффективное потребление питательных веществ и ассимилятов для образования цветков и плодов, а не для роста вегетативных частей растений.

В качестве альтернативы, регуляторы роста также могут быть использованы для стимулирования вегетативного развития. Это весьма целесообразно, когда при сборе урожая собирают вегетативные части растения. Однако при стимулировании вегетативного развития может также стимулироваться генеративное развитие, поскольку в этом случае происходит образование большего количества ассимилятов, что приводит к образованию большего количества плодов или к образованию плодов большего размера.

Кроме того, положительные эффекты на рост растений или урожайность могут быть достигнуты за счет улучшения эффективности использования питательных веществ, в частности, эффективности использования азота (N), эффективности использования фосфора (P), эффективности использования воды, улучшения транспирации, интенсивности дыхания и/или ассимиляции CO₂, улучшения образования клубеньков, улучшения Са-метаболизма и т.д.

Аналогичным образом, регуляторы роста могут быть использованы для изменения состава растений, что в свою очередь может привести к улучшению качества урожая. Регуляторы роста могут оказывать влияние на образование партенокарпических плодов. В дополнение, можно влиять на пол цветка. Также возможно получение стерильной пыльцы, что важно при селекции и получении гибридных семян.

Использованием регуляторов роста можно контролировать ветвеобразование у растений. С другой стороны при нарушении апикального доминирования можно стимулировать развитие боковых побегов, что может быть желательным в особенности при культивировании декоративных растений, также в комбинации с подавлением роста. С другой стороны также возможно подавлять рост боковых побегов. Такой эффект представляет особый интерес, например, при выращивании табака или томатов.

Под воздействием регуляторов роста можно регулировать количество листьев на растениях, так, чтобы в необходимое время происходила дефолиация. Такая дефолиация играет важную роль при механическом сборе урожая хлопка, но также и при сборе урожая других культур, например, при возделывании винограда. Дефолиация растений также может осуществляться для снижения транспирации у растений перед пересадкой.

Кроме того, регуляторы роста могут модулировать старение растений, что может привести к увеличению продолжительности периода с зелеными листьями, увеличению фазы заполнения зерна, повышению качества урожая и т.д.

Также регуляторы роста могут быть использованы для регулирования вскрытия плода. С другой стороны, таким образом можно предотвращать преждевременное вскрытие плода. С другой стороны, также можно стимулировать вскрытие плода или даже недоразвитие цветка для достижения необходимой массы ("прореживание завязей"). В дополнение, регуляторы роста могут быть использованы для того, чтобы во время сбора урожая плоды отделялись от растения с применением меньшей физической силы для обеспечения возможности механической уборки урожая или для облегчения ручной уборки.

Регуляторы роста могут быть также использованы для получения более раннего или наоборот, более позднего созревания собираемого материала до или после урожая. Это является особенно важным, так как это позволяет наилучшим образом подстраиваться под требования рынка. Кроме того, в некоторых случаях регуляторы роста могут улучшать цвет плодов. В дополнение, регуляторы роста могут быть также использованы для того, чтобы созревание происходило в течение определенного периода времени. Таким образом, создаются необходимые условия

для того, чтобы обеспечить возможность механической или ручной уборки урожая в один этап, например, в случае табака, томатов или кофе.

В дополнение, с использованием регуляторов роста растений можно влиять на период покоя семян или почек растений так, чтобы, например, прорастание, побегообразование, цветение растений, таких как ананас или декоративные растения в питомниках, происходило в такие периоды, когда это не является обычным. В районах, где высока вероятность заморозков, с помощью регуляторов роста желательно обеспечить задержку в распускании почек или прорастании семян для того, чтобы избежать ущерба вследствие поздних заморозков.

Наконец, регуляторы роста могут придать растениям устойчивость к низким температурам, засухе или засоленности почвы. Этим обеспечивается возможность культивирования растений в районах непригодных, как правило, для таких целей.

Придание устойчивости / Жизнестойкость растений и другие эффекты

Соединение и композиция согласно изобретению также проявляют сильное укрепляющее воздействие на растения. Соответственно, они могут быть использованы для мобилизации защитной системы растения против атаки вредных микроорганизмов.

Под веществами, повышающими жизнестойкость растений (придающими растениям устойчивость), в контексте настоящего изобретения подразумевают вещества, способные стимулировать защитную систему растения таким образом, чтобы обработанные растения впоследствии, при инокулировании их вредоносными микроорганизмами развивали бы высокую степень устойчивости к этим микроорганизмам.

Также, в контексте настоящего изобретения физиологические характеристики растения включают следующее:

Устойчивость к абиотическому стрессу, что включает устойчивость к воздействию высоких или низких температур, устойчивость к засухе и способность восстанавливаться после стрессовых засушливых условий, эффективность использования воды (что взаимосвязано со сниженным водопотреблением), устойчивость к затоплению, озоновый стресс и устойчивость к ультрафиолетовому излучению, устойчивость к химическим веществам, таким как тяжелые металлы, соли, пестициды и т.д.

Устойчивость к абиотическому стрессу, что включает повышенную устойчивость к грибам и повышенную устойчивость к нематодам, вирусам и бактериям. В контексте настоящего изобретения устойчивость к абиотическому стрессу предпочтительно включает повышенную устойчивость к грибам и повышенную устойчивость к нематодам.

Повышенная мощность растений, включая повышенную жизнестойкость растений/повышенное качество растений и повышенную энергию прорастания семян, сниженную склонность к полеганию, улучшенный внешний вид, повышенную способность к восстановлению после стрессовых условий, улучшенную пигментацию (например, содержание хлорофилла, улучшенную способность к сохранению зеленой окраски и т.д.) и улучшенный коэффициент полезного действия фотосинтеза.

Примеры получения

Получение и применение активных ингредиентов формулы (I) согласно изобретению иллюстрируется следующими примерами. Однако, изобретение не ограничивается этими примерами.

Общий порядок действий для этапа (a)

2-хлор-5-метил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)анилин

Смесь 4-бром-2-хлор-5-метиланилина (1.5 г, 6.8 ммоль, 1 экв.), бис(пинакол)дихлорида (2.59 г, 10.2 ммоль, 1.5 экв.), Pd(dppf)Cl₂ (0.75 г, 1.02 ммоль, 0.15 экв.) и ацетата калия (2 г, 20.4 ммоль, 3 экв.) в ДМФ (30 мЛ) перемешивали в атмосфере аргона при 95°C в течение 16 часов. После завершения реакции смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенный органический слой промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (1.92 г, 84% выхода).

Общий порядок действий для этапа (b)

2-хлор-4-[(2-фторфенил)метил]-5-метил-анилин

Смесь 2-фторбензилхлорида (435 мг, 3 ммоль, 1 экв.), 2-хлор-5-метил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)анилина (966 мг, 3.61 ммоль, 1.2

экв.), карбоната цезия (3.92 г, 12 ммоль, 4 экв.) и тетраakis(трифенилфосфин)палладия (70 мг, 0.06 ммоль, 0.02 экв.) в 1-бутаноле (20 мл) и воде (5 мл) перемешивали в атмосфере аргона при 80°C в течение 16 часов. После завершения смесь отфильтровали, разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (373 мг, 41% выхода).

Общий порядок действий для этапа (c)

1,4-Диметил-2-нитро-5-(1-фенилвинил)бензол

Смесь 1-фенилвинилбороновой кислоты (1 г, 6.75 ммоль, 1.25 экв.), 4-бром-2,5-диметилнитробензола (1.24 г, 5.4 ммоль, 1 экв.) и тетраakis(трифенилфосфин)палладия (0.32 г, 0.28 ммоль, 0.05 экв.) в толуоле (10 мл) и 2М карбонат натрия (8 мл) перемешивали в атмосфере аргона при 90°C в течение 4 часов. После завершения смесь отфильтровали, разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (917 мг, 49% выхода).

Общий порядок действий для этапа (d) - циклопропил

1,4-Диметил-2-нитро-5-(1-фенилциклопропил)бензол

1.5М раствора диэтилцинк (2.63 мл, 4 ммоль, 2 экв.) добавили при 0°C к раствору 1,4-диметил-2-нитро-5-(1-фенилвинил)бензола (500 мг, 2 ммоль, 1 экв.) в DCM (5 мл) с последующим добавлением дийодметана (0.32 мл, 4 ммоль, 2 экв.), и полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. После завершения смесь разбавили водой, нейтрализовали 1М HCl и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении с получением неочищенного указанного в

заголовке соединения (640 мг), которое использовали непосредственно на следующем этапе.

Общий порядок действий для этапа (d) - дифторциклопропил

1-(2,2-Дифтор-1-фенил-циклопропил)-2,5-диметил-4-нитро-бензол

Смесь 1,4-диметил-2-нитро-5-(1-фенилвинил)бензола (1.3 г, 5.1 ммоль, 1 экв.) и бромдифторацетата натрия (2.02 г, 10.3 ммоль, 2 экв.) в диметиловом эфире диэтиленгликоля (50 мЛ) перемешивали при 150°C в течение 13 часов. Смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (240 мг, 14% выхода).

Общий порядок действий для этапа (d) - дибромциклопропил

1-(2,2-Дибром-1-фенил-циклопропил)-2,5-диметил-4-нитро-бензол

Бромформ (0.69 мЛ, 7.9 ммоль, 8 экв.) добавили к смеси 1,4-диметил-2-нитро-5-(1-фенилвинил)бензола (250 мг, 0.98 ммоль, 1 экв.) и тетра(н-бутил)аммоний бромида (16 мг, 0.04 ммоль, 0.05 экв.) в конц. гидроксиде натрия (0.6 мЛ), и полученную смесь перемешивали при 50°C в течение 16 часов. Смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (470 мг, 94% выхода).

Общий порядок действий для этапа (e)

4-(2,2-Дифтор-1-фенил-циклопропил)-2,5-диметил-анилин

Смесь 1-(2,2-дифтор-1-фенил-циклопропил)-2,5-диметил-4-нитро-бензола (240 мг, 0.79 ммоль, 1 экв.) и дигидрата хлорида олова (893 мг, 3.96 ммоль, 5 экв.) в этаноле (15 мЛ) перемешивали с обратным холодильником в течение 30 мин. После завершения смесь разбавили водой, нейтрализовали карбонатом натрия и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель

удалили при пониженном давлении с получением неочищенного указанного в заголовке соединения (140 мг, 56% выхода), которое использовали непосредственно на следующем этапе.

Общий порядок действий для этапа (f)

N'-[4-[(2-Цианофенил)метил]-2,5-диметил-фенил]-N-этил-N-метил-формамидин (Прим. № 8)

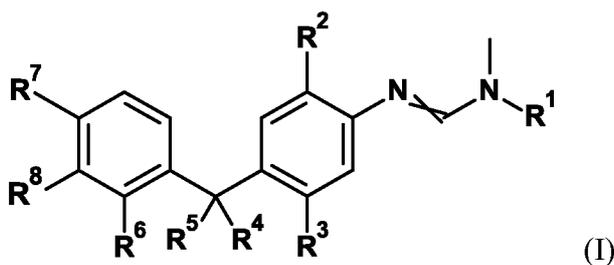
Смесь 2-[(4-амино-2,5-диметил-фенил)метил]бензонитрила (180 мг, 0.76 ммоль, 1 экв.) и N-(диметоксиметил)-N-метил-этанамин (152 мг, 1.14 ммоль, 1.5 экв.) в толуоле (5 мЛ) перемешивали при 80°C в течение 4 часов. После завершения смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промыли раствором брина, высушили над безводным сульфатом натрия, и растворитель удалили при пониженном давлении. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (этилацетат/с-гексан) получили указанное в заголовке соединение (164 мг, 70% выхода).

Общий порядок действий для этапа (g)

2-хлор-4-[(2-хлорфенил)метил]-5-метил-анилин

В атмосфере аргона, 0.5М раствора 2-хлорбензилцинк хлорида (4 мЛ, 2 ммоль, 1.1 экв.) добавили к суспензии 4-бром-2-хлор-5-метил-анилина (400 мг, 1.81 ммоль, 1 экв.), Pd(OAc)₂ (4 мг, 0.02 ммоль, 0.01 экв.) и S-Phos (15 мг, 0.04 ммоль, 0.02 экв.) в ТГФ (5 мЛ), и полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 24 часов. После завершения реакцию разбавили этилацетатом, промыли последовательно водой и брином, высушили над сульфатом натрия и сконцентрировали в вакууме. В результате очистки с помощью препаративной ВЭЖХ получили указанное в заголовке соединение (252 мг, 52% выхода).

Примеры



Прим. №	LogP	Перечень пиков ЯМР	Название по номенклатуре IUPAC
1	1.41[a]; 3.86[b]	Пример 1: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.852 (2.1); 7.833 (2.2); 7.730 (1.1); 7.662 (1.0); 7.659 (1.0); 7.642 (2.2); 7.639 (2.2); 7.623 (1.6); 7.620 (1.6); 7.456 (1.4); 7.437 (2.3); 7.419 (1.0); 7.211 (2.2); 7.192 (2.0); 6.944 (5.9); 6.842 (1.5); 5.756 (1.2); 4.079 (8.4); 3.422 (0.5); 3.347 (1.1); 3.320 (11.9); 2.986 (1.4); 2.918 (3.7); 2.671 (0.3); 2.506 (46.0); 2.502 (60.8); 2.497 (44.2); 2.328 (0.3); 2.146 (16.0); 1.398 (0.4); 1.149 (1.9); 1.132 (3.8); 1.115 (2.1); 0.008 (0.6); 0.000 (17.3)	N'-[2-хлор-4-[(2- цианофенил)метил]-5- метилфенил]-N-этил-N- метилметанимидаид
2	1.52[a]; 4.50[b]	Пример 2: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.706 (1.2); 7.592 (0.4); 7.306 (0.4); 7.300 (0.4); 7.286 (1.0); 7.268 (1.4); 7.253 (0.7); 7.249 (0.7); 7.200 (1.5); 7.177 (1.7); 7.154 (1.0); 7.148 (1.1); 7.129 (2.4); 7.109 (1.9); 7.100 (1.4); 7.085 (1.6); 7.082 (1.5); 7.066 (0.6); 6.977 (5.3); 6.804 (1.6); 3.873 (7.7); 3.428 (0.5); 3.414 (0.5); 3.321 (52.1); 2.977 (1.4); 2.912 (3.7); 2.670 (0.4); 2.506 (55.8); 2.501 (72.3); 2.497 (55.0); 2.328 (0.4); 2.152 (16.0); 2.067 (0.4); 1.144 (2.2); 1.127 (4.4); 1.110 (2.4); 0.000 (64.6)	N'-[2-хлор-4-[(2- фторфенил)метил]-5- метилфенил]-N-этил-N- метилметанимидаид
3	1.49[a]	Пример 3: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.696 (1.0); 7.583 (0.4); 7.301 (1.7); 7.283 (4.5); 7.264 (3.3); 7.197 (1.4); 7.179 (2.2); 7.160 (0.8); 7.137 (4.1); 7.118 (3.4); 7.062 (5.7); 6.778 (1.5); 3.865 (8.2); 3.414 (0.5); 3.321 (52.3); 2.973 (1.2); 2.911 (3.2); 2.670 (0.4); 2.505 (45.1); 2.501 (61.4); 2.497 (47.2); 2.328 (0.4); 2.123 (16.0); 2.040 (0.4); 1.142 (2.5); 1.125 (5.1); 1.107 (2.5); 0.008 (2.2); 0.000 (58.0); -0.008 (3.1)	N'-(4-бензил-2-хлор-5- метилфенил)-N-этил-N- метилметанимидаид

4	1.38[a]; 4.38[b]	Пример 4: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.837 (2.7); 7.819 (2.9); 7.752 (1.2); 7.638 (1.6); 7.618 (2.8); 7.599 (1.7); 7.438 (1.8); 7.419 (3.0); 7.400 (1.4); 7.186 (3.0); 7.166 (2.8); 6.999 (6.1); 6.914 (1.6); 5.757 (1.3); 4.157 (11.3); 3.424 (0.6); 3.349 (1.3); 3.324 (36.5); 2.984 (1.5); 2.916 (3.8); 2.507 (38.9); 2.502 (50.6); 2.498 (36.5); 2.120 (16.0); 1.142 (2.6); 1.125 (5.1); 1.108 (2.7); 0.000 (8.5)	N'-[5-хлор-4-[(2- цианофенил)метил]-2- метилфенил]-N-этил-N- метилметанимидаמיד
5	1.58[a]; 2.99[b]	Пример 5: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.729 (1.0); 7.622 (0.4); 7.290 (0.4); 7.283 (0.6); 7.276 (0.8); 7.270 (1.1); 7.255 (1.6); 7.248 (1.0); 7.239 (0.8); 7.234 (0.8); 7.185 (1.9); 7.162 (2.0); 7.159 (2.0); 7.139 (1.3); 7.131 (0.9); 7.111 (2.9); 7.104 (2.0); 7.096 (3.9); 7.085 (1.8); 7.081 (1.7); 7.067 (0.6); 6.966 (5.5); 6.879 (1.6); 3.955 (9.7); 3.416 (0.6); 3.331 (84.7); 2.976 (1.3); 2.910 (3.4); 2.671 (0.4); 2.667 (0.3); 2.506 (55.7); 2.502 (74.2); 2.498 (55.8); 2.329 (0.4); 2.103 (16.0); 1.232 (1.4); 1.138 (2.6); 1.121 (4.9); 1.104 (2.7); 0.008 (2.7); 0.000 (71.3); -0.008 (3.3)	N'-[5-хлор-4-[(2- фторфенил)метил]-2- метилфенил]-N-этил-N- метилметанимидаמיד
6	1.72[a]; 5.16[b]	Пример 6: ¹ H-NMR(601.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 19.971 (0.3); 7.712 (0.7); 7.603 (0.3); 7.280 (3.3); 7.268 (6.0); 7.260 (1.1); 7.255 (5.7); 7.179 (9.0); 7.168 (7.3); 7.156 (1.3); 7.040 (6.6); 6.850 (1.1); 3.941 (12.8); 3.419 (0.5); 3.332 (0.9); 3.304 (70.5); 2.972 (0.9); 2.906 (2.3); 2.612 (0.6); 2.521 (1.1); 2.518 (1.4); 2.515 (1.3); 2.506 (33.9); 2.503 (77.0); 2.500 (108.8); 2.497 (78.1); 2.494 (35.4); 2.384 (0.6); 2.178 (0.5); 2.110 (16.0); 1.130 (2.1); 1.119 (4.1); 1.108 (2.4); 0.005 (0.4); 0.000 (17.8); - 0.006 (0.5)	N'-(4-бензил-5-хлор-2- метилфенил)-N-этил-N- метилметанимидаמיד

7	1.92[a]; 6.40[b]	<p>Пример 7: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.605 (0.5); 7.586 (0.4); 7.470 (0.4); 7.460 (2.1); 7.452 (2.1); 7.447 (1.7); 7.437 (2.6); 7.428 (0.4); 7.256 (0.7); 7.246 (5.2); 7.237 (4.0); 7.231 (3.8); 7.223 (5.1); 7.213 (0.6); 6.958 (1.9); 6.948 (1.6); 6.944 (1.8); 6.935 (1.6); 6.699 (5.3); 6.602 (3.7); 3.907 (9.8); 3.317 (43.1); 2.918 (3.6); 2.675 (0.4); 2.670 (0.6); 2.666 (0.4); 2.523 (1.8); 2.510 (33.9); 2.506 (68.4); 2.501 (93.2); 2.497 (70.1); 2.492 (34.6); 2.332 (0.4); 2.328 (0.5); 2.324 (0.4); 2.087 (16.0); 2.072 (15.7); 1.998 (0.3); 1.988 (0.9); 1.398 (2.9); 1.175 (0.5); 1.136 (4.9); 1.118 (10.5); 1.100 (4.8); 0.008 (1.2); 0.000 (30.4); -0.008 (1.2)</p>	N'-[4-[(2-хлорфенил)метил]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד
8	1.47[a]; 4.15[b]	<p>Пример 8: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.827 (2.4); 7.825 (2.5); 7.808 (2.6); 7.806 (2.7); 7.625 (1.6); 7.622 (1.6); 7.606 (3.1); 7.603 (3.1); 7.586 (2.0); 7.584 (1.9); 7.421 (1.6); 7.402 (2.7); 7.383 (1.2); 7.153 (2.7); 7.134 (2.5); 6.749 (5.4); 6.604 (3.8); 4.042 (9.7); 3.319 (60.2); 2.917 (4.1); 2.670 (0.4); 2.666 (0.4); 2.505 (55.1); 2.501 (73.1); 2.497 (58.4); 2.328 (0.4); 2.114 (16.0); 2.080 (15.6); 1.398 (1.1); 1.133 (4.7); 1.116 (9.7); 1.098 (4.5); 0.000 (15.6)</p>	N'-[4-[(2-цианофенил)метил]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד
9	1.79[a]; 4.86[b]	<p>Пример 9: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.585 (0.5); 7.214 (1.0); 7.208 (1.0); 7.188 (1.5); 7.184 (1.5); 7.164 (1.0); 7.158 (1.0); 7.074 (0.5); 7.053 (1.5); 7.035 (1.7); 7.014 (1.1); 7.006 (1.3); 7.000 (1.2); 6.984 (1.8); 6.978 (1.7); 6.963 (0.6); 6.957 (0.6); 6.774 (4.9); 6.574 (3.6); 3.805 (7.5); 3.319 (38.3); 2.912 (3.9); 2.670 (0.3); 2.505 (44.3); 2.501 (59.0); 2.497 (45.0); 2.328 (0.3); 2.202 (0.6); 2.109 (16.0); 2.080 (15.1); 1.988 (0.4); 1.398 (1.1); 1.130 (4.7); 1.112 (9.6); 1.094 (4.5); 0.000 (0.6)</p>	N'-[4-[(2,4-дифторфенил)метил]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד

10	1.60[a]; 4.87[b]	<p>Пример 10: $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ= 7.584 (0.5); 7.268 (0.4); 7.264 (0.4); 7.249 (1.1); 7.230 (1.6); 7.225 (1.0); 7.216 (0.8); 7.211 (0.8); 7.172 (1.7); 7.150 (1.8); 7.147 (1.8); 7.129 (1.1); 7.126 (1.1); 7.109 (1.2); 7.107 (1.2); 7.091 (2.6); 7.088 (2.5); 7.072 (1.6); 7.070 (1.6); 7.039 (1.2); 7.035 (1.2); 7.020 (1.8); 7.016 (1.8); 7.001 (0.8); 6.997 (0.7); 6.926 (0.4); 6.787 (4.9); 6.572 (3.7); 6.555 (0.4); 5.753 (0.8); 3.836 (8.1); 3.751 (0.4); 3.317 (31.6); 2.912 (4.2); 2.523 (0.7); 2.510 (17.2); 2.506 (36.0); 2.501 (50.4); 2.496 (38.2); 2.492 (18.9); 2.202 (1.9); 2.118 (16.0); 2.079 (15.5); 2.033 (0.9); 1.988 (1.0); 1.960 (1.0); 1.398 (2.9); 1.175 (0.5); 1.130 (5.0); 1.113 (10.7); 1.095 (4.9); 0.008 (0.9); 0.000 (27.5); -0.008 (1.0)</p>	<p>N-этил-N'-[4-[(2- фторфенил)метил]-2,5- диметилфенил]-N- метилметанимидаид</p>
11	1.58[a]; 4.90[b]	<p>Пример 11: $^1\text{H-NMR}$(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ= 7.570 (0.4); 7.271 (1.6); 7.253 (4.4); 7.234 (3.4); 7.217 (0.4); 7.164 (1.3); 7.146 (2.1); 7.128 (1.0); 7.116 (3.6); 7.098 (3.1); 7.075 (0.3); 6.855 (4.2); 6.694 (0.4); 6.546 (3.1); 6.401 (0.5); 4.558 (0.5); 3.833 (7.2); 3.749 (0.8); 3.318 (22.6); 2.910 (3.6); 2.523 (0.6); 2.509 (11.1); 2.505 (23.3); 2.500 (32.6); 2.496 (24.5); 2.491 (11.9); 2.202 (0.7); 2.095 (16.0); 2.011 (1.5); 1.979 (1.5); 1.128 (4.4); 1.111 (9.6); 1.093 (4.3); 0.008 (0.6); 0.000 (19.2); - 0.008 (0.7)</p>	<p>N'-(4-бензил-2,5- диметилфенил)-N-этил- N-метилметанимидаид</p>

12	1.92[a]; 5.31[b]	<p>Пример 12: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.650 (0.5); 7.214 (1.0); 7.207 (1.0); 7.188 (1.4); 7.183 (1.5); 7.164 (1.0); 7.158 (1.0); 7.074 (0.6); 7.053 (1.6); 7.036 (1.6); 7.014 (1.1); 7.005 (1.3); 6.999 (1.3); 6.984 (1.8); 6.978 (1.7); 6.963 (0.7); 6.956 (0.6); 6.774 (4.9); 6.575 (3.5); 3.804 (7.4); 3.720 (0.4); 3.318 (40.6); 2.818 (14.0); 2.670 (0.4); 2.524 (0.9); 2.510 (23.9); 2.506 (50.3); 2.501 (70.3); 2.497 (53.3); 2.492 (26.4); 2.332 (0.3); 2.328 (0.4); 2.324 (0.3); 2.203 (0.6); 2.157 (0.4); 2.110 (16.0); 2.079 (15.1); 2.023 (0.8); 1.961 (0.8); 1.398 (0.3); 1.172 (8.3); 1.156 (8.3); 0.000 (0.8)</p>	N'-[4-[(2,4- дифторфенил)метил]- 2,5-диметилфенил]-N- изопропил-N- метилметанимидаמיד
13	1.85[a]	<p>Пример 13: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.601 (0.5); 7.204 (2.2); 7.186 (4.9); 7.166 (3.7); 7.090 (1.9); 7.075 (6.5); 7.053 (1.1); 6.936 (4.8); 6.918 (4.2); 6.903 (0.4); 6.554 (3.8); 3.322 (35.8); 2.922 (4.4); 2.506 (43.1); 2.501 (57.6); 2.497 (43.1); 2.328 (0.3); 2.149 (15.5); 2.064 (16.0); 2.024 (0.6); 1.989 (0.6); 1.398 (4.1); 1.292 (1.3); 1.275 (4.6); 1.266 (2.0); 1.225 (0.6); 1.186 (1.9); 1.177 (4.5); 1.173 (4.1); 1.161 (1.3); 1.136 (5.4); 1.119 (11.4); 1.101 (5.2); 0.008 (1.5); 0.000 (32.6)</p>	N'-[2,5-диметил-4-(1- фенилциклопропил)фен ил]-N-этил-N- метилметанимидаמיד
14	1.63[a]	<p>Пример 14: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 7.594 (0.4); 7.335 (1.3); 7.318 (9.8); 7.301 (4.8); 7.281 (1.6); 7.268 (0.4); 7.264 (0.3); 7.249 (1.0); 7.235 (1.2); 7.230 (2.0); 7.224 (1.0); 7.220 (1.0); 7.214 (1.8); 7.203 (4.2); 7.182 (0.7); 7.163 (0.6); 6.554 (2.9); 3.365 (0.4); 3.323 (48.2); 2.908 (2.9); 2.523 (0.8); 2.510 (19.3); 2.505 (39.8); 2.501 (52.9); 2.496 (38.0); 2.492 (18.3); 2.445 (0.5); 2.423 (0.7); 2.411 (0.5); 2.402 (0.5); 2.390 (0.4); 2.328 (0.3); 2.300 (2.5); 2.162 (16.0); 2.158 (15.9); 2.080 (0.4); 2.031 (0.7); 2.019 (0.5); 2.010 (0.5); 1.998 (0.9); 1.985 (0.6); 1.976 (0.5); 1.965 (0.4); 1.883 (0.5); 1.398 (7.1); 1.124 (4.7); 1.107 (10.0); 1.089 (4.5); 0.008 (1.8); 0.000 (48.7); -0.008 (2.1)</p>	N'-[4-(2,2-дифтор-1- фенилциклопропил)- 2,5-диметилфенил]-N- этил-N- метилметанимидаמיד

15	1.83[a]	<p>Пример 15: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.594 (0.9); 7.541 (0.6); 7.493 (7.2); 7.474 (8.7); 7.327 (4.5); 7.308 (9.0); 7.289 (5.3); 7.222 (3.4); 7.204 (4.8); 7.185 (1.8); 6.520 (1.4); 5.755 (4.0); 3.322 (58.4); 2.904 (7.0); 2.775 (0.5); 2.671 (0.9); 2.501 (125.5); 2.422 (0.6); 2.395 (0.6); 2.364 (0.6); 2.328 (1.4); 2.174 (8.5); 2.092 (1.3); 2.073 (1.2); 1.481 (0.4); 1.467 (0.4); 1.298 (0.3); 1.258 (0.6); 1.235 (1.1); 1.150 (0.4); 1.119 (7.8); 1.101 (16.0); 1.083 (7.7); 1.012 (0.4); 0.995 (0.4); 0.000 (61.9)</p>	<p>N'-[4-(2,2-дихлор-1-фенилциклопропил)-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד</p>
16	1.89[a]	<p>Пример 16: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.501 (7.0); 7.482 (7.7); 7.321 (3.2); 7.302 (6.4); 7.283 (3.8); 7.213 (3.0); 7.194 (4.2); 7.176 (1.7); 6.460 (0.8); 5.754 (12.8); 3.319 (25.2); 2.894 (5.6); 2.673 (0.4); 2.669 (0.5); 2.664 (0.4); 2.522 (2.0); 2.509 (30.6); 2.504 (62.0); 2.500 (82.3); 2.495 (59.5); 2.491 (29.2); 2.331 (0.6); 2.327 (0.7); 2.322 (0.6); 2.277 (0.5); 2.251 (1.0); 2.197 (3.7); 2.148 (3.3); 2.081 (0.7); 1.234 (0.6); 1.149 (0.3); 1.112 (7.5); 1.095 (16.0); 1.077 (7.2); 0.008 (0.7); 0.000 (20.4); -0.009 (0.9)</p>	<p>N'-[4-(2,2-дибром-1-фенилциклопропил)-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד</p>
18	1.58 ^[a] ; 5.32 ^[b]	<p>Пример 18: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.6983 (0.9); 7.5942 (0.4); 7.2863 (1.9); 7.2674 (5.1); 7.2493 (4.8); 7.2152 (6.3); 7.1973 (3.3); 7.1716 (1.8); 7.1539 (2.6); 7.1391 (0.7); 7.1360 (1.0); 7.0963 (5.7); 6.8146 (1.7); 5.7559 (1.1); 4.4578 (0.6); 4.4399 (2.1); 4.4219 (2.2); 4.4039 (0.6); 3.4069 (0.5); 3.3240 (8.2); 2.9586 (1.2); 2.9011 (3.2); 2.5051 (12.6); 2.5008 (16.0); 2.4964 (11.4); 2.1331 (16.0); 1.5393 (9.3); 1.5212 (9.1); 1.3964 (2.8); 1.1283 (3.5); 1.1107 (6.7); 1.0931 (3.3)</p>	<p>N'-[5-хлор-2-метил-4-(1-фенилэтил)фенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד</p>

19	1.58 ^[a] ; 5.24 ^[b]	<p>Пример 19: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7935 (1.3); 7.6874 (0.5); 7.3394 (1.1); 7.3348 (1.7); 7.3309 (0.9); 7.3183 (4.9); 7.3137 (3.0); 7.2998 (5.8); 7.2889 (1.5); 7.2848 (3.0); 7.2810 (2.4); 7.2744 (1.1); 7.2678 (3.1); 7.2587 (0.9); 7.2497 (6.2); 7.2456 (6.6); 7.2329 (2.2); 7.2290 (4.2); 7.0860 (0.5); 7.0654 (0.7); 7.0482 (6.5); 6.8999 (1.7); 6.8479 (0.8); 6.8309 (0.6); 5.8120 (5.5); 5.8099 (5.5); 5.2060 (5.6); 5.2041 (5.5); 3.4443 (0.7); 3.4067 (0.4); 3.3682 (1.4); 3.3510 (1.5); 3.3201 (32.5); 3.0015 (1.7); 2.9390 (4.3); 2.6707 (0.4); 2.5233 (1.5); 2.5099 (25.7); 2.5057 (51.6); 2.5013 (67.7); 2.4968 (48.9); 2.3327 (0.4); 2.3281 (0.4); 2.1771 (16.0); 2.1377 (3.1); 1.3973 (0.5); 1.1573 (3.6); 1.1398 (7.5); 1.1224 (4.1); -0.0002 (6.4)</p>	N'-[5-хлор-2-метил-4-(1-фенилэтен-1-ил)фенил]-N-этил-N-метилметанимидаид
20	2.00 ^[a] ; 4.62 ^[b]	<p>Пример 20: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.6963 (1.0); 7.5952 (0.4); 7.2864 (2.2); 7.2676 (5.4); 7.2492 (5.3); 7.2320 (0.6); 7.1908 (6.7); 7.1848 (3.8); 7.1716 (4.5); 7.1645 (3.7); 7.1461 (1.5); 6.9778 (3.1); 6.9556 (3.0); 6.6402 (1.0); 6.6110 (1.1); 6.3658 (0.4); 6.3352 (0.4); 4.9662 (0.6); 3.8334 (10.1); 3.7380 (1.0); 3.4108 (0.6); 3.3228 (10.2); 2.9568 (1.3); 2.9056 (3.3); 2.5053 (21.2); 2.5010 (26.7); 2.4968 (19.8); 2.0954 (16.0); 1.9625 (1.9); 1.1320 (3.6); 1.1144 (7.2); 1.0968 (3.6)</p>	N'-(4-бензил-5-фтор-2-метилфенил)-N-этил-N-метилметанимидаид

21	1.86 ^[a] ; 4.60 ^[b]	<p>Пример 21: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7077 (1.2); 7.5939 (0.5); 7.2451 (0.9); 7.2386 (0.9); 7.2188 (1.4); 7.2151 (1.4); 7.1955 (1.0); 7.1892 (1.0); 7.1512 (0.6); 7.1297 (1.5); 7.1123 (1.5); 7.0912 (0.8); 7.0422 (1.0); 7.0369 (1.0); 7.0210 (1.6); 7.0157 (1.5); 6.9997 (0.7); 6.9943 (0.7); 6.9796 (5.3); 6.8071 (1.6); 3.8453 (7.2); 3.4173 (0.6); 3.3393 (1.3); 3.3200 (25.4); 2.9789 (1.5); 2.9128 (3.8); 2.6708 (0.4); 2.5061 (51.6); 2.5017 (63.8); 2.4973 (46.8); 2.3285 (0.4); 2.2292 (0.4); 2.1423 (16.0); 1.1446 (2.3); 1.1277 (4.4); 1.1106 (2.4); -0.0002 (0.5)</p>	N'-[2-хлор-4-[(2,4-дифторфенил)метил]-5-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаид
22	1.63 ^[a]	<p>Пример 22: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7285 (1.1); 7.6207 (0.4); 7.2264 (1.1); 7.2199 (1.2); 7.2015 (1.7); 7.1954 (2.2); 7.1770 (1.2); 7.1705 (1.2); 7.1503 (0.8); 7.1289 (1.9); 7.1103 (2.2); 7.0901 (1.1); 7.0257 (1.4); 7.0195 (1.4); 7.0082 (1.5); 7.0044 (1.6); 7.0017 (1.7); 6.9863 (1.1); 6.9796 (1.1); 6.9659 (5.8); 6.8807 (1.6); 5.7558 (3.7); 4.0390 (0.7); 4.0212 (0.7); 3.9230 (8.9); 3.4156 (0.6); 3.3420 (1.3); 3.3221 (7.3); 2.9767 (1.4); 2.9104 (3.6); 2.5115 (10.2); 2.5073 (19.8); 2.5028 (26.1); 2.4984 (19.6); 2.4943 (10.1); 2.1417 (0.8); 2.1078 (16.0); 1.9893 (2.8); 1.3974 (7.7); 1.1935 (0.8); 1.1757 (1.5); 1.1578 (0.9); 1.1382 (2.7); 1.1212 (5.1); 1.1041 (2.7); 0.0078 (0.7); -0.0002 (17.5); -0.0079 (0.8)</p>	N'-[5-хлор-4-[(2,4-дифторфенил)метил]-2-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаид

23	1.66 ^[a] ; 5.54 ^[b]	<p>Пример 23: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7422 (0.8); 7.1857 (1.0); 7.1802 (1.2); 7.1641 (2.1); 7.1383 (0.6); 7.1339 (0.7); 7.1200 (2.0); 7.1150 (2.2); 7.1047 (2.9); 7.0946 (1.9); 7.0895 (1.6); 7.0757 (0.6); 7.0715 (0.5); 6.8889 (2.6); 6.8726 (1.9); 6.8672 (1.6); 6.7643 (4.6); 5.7551 (0.6); 3.8983 (8.5); 3.8046 (0.3); 3.4136 (0.5); 3.3504 (0.9); 3.3202 (9.7); 2.9807 (1.0); 2.9113 (2.5); 2.5055 (29.5); 2.5013 (38.1); 2.4970 (28.7); 2.2290 (16.0); 2.1408 (0.5); 2.0678 (12.7); 1.9883 (0.6); 1.9409 (0.6); 1.3976 (2.7); 1.1747 (0.3); 1.1563 (0.4); 1.1416 (1.9); 1.1246 (3.6); 1.1078 (2.1); 0.0075 (0.7); -0.0002 (17.6)</p>	<p>N'-[5-хлор-2-метил-4-[(2-метилфенил)метил]фенил]-N-этил-N-метилметанимидамид</p>
24	1.63 ^[a] ; 4.92 ^[b]	<p>Пример 24: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7338 (1.1); 7.6249 (0.4); 7.3091 (0.5); 7.3056 (0.5); 7.2849 (1.3); 7.2633 (1.3); 7.2426 (0.7); 7.2392 (0.6); 7.1459 (0.7); 7.1420 (0.7); 7.1326 (0.7); 7.1259 (1.3); 7.1221 (1.3); 7.1125 (1.2); 7.1090 (1.4); 7.1018 (0.7); 7.0924 (0.6); 7.0889 (0.6); 7.0108 (5.5); 6.9130 (1.2); 6.8935 (3.0); 6.8777 (1.9); 4.0024 (9.0); 3.4151 (0.6); 3.3438 (1.3); 3.3220 (45.8); 2.9803 (1.3); 2.9114 (3.5); 2.6753 (0.3); 2.6708 (0.5); 2.6663 (0.3); 2.5241 (1.2); 2.5063 (64.3); 2.5020 (83.8); 2.4976 (60.1); 2.3330 (0.4); 2.3288 (0.5); 2.3244 (0.4); 2.1152 (16.0); 1.1395 (2.4); 1.1222 (4.7); 1.1051 (2.6); 0.0077 (1.8); -0.0002 (48.7); -0.0083 (1.9)</p>	<p>N'-[5-хлор-4-[(2,3-дифторфенил)метил]-2-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид</p>

25	2.05 ^[a] , 6.02 ^[b]	<p>Пример 25: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7120 (0.9); 7.6035 (0.4); 7.4517 (1.8); 7.4345 (5.2); 7.4157 (4.7); 7.3876 (2.4); 7.3752 (0.8); 7.3697 (2.8); 7.3627 (0.6); 7.3513 (0.8); 7.3200 (4.7); 7.3162 (5.7); 7.2991 (4.7); 7.2929 (4.3); 7.2840 (3.6); 7.2788 (3.9); 7.2701 (5.3); 7.2603 (0.9); 7.2389 (0.6); 7.2289 (2.9); 7.2200 (2.1); 7.2153 (1.6); 7.2062 (1.5); 7.0425 (0.4); 7.0339 (2.0); 7.0231 (1.7); 7.0200 (1.8); 7.0113 (1.8); 6.8164 (1.5); 6.7179 (5.8); 3.8752 (10.6); 3.4058 (0.6); 3.3222 (43.7); 2.9683 (1.2); 2.9001 (3.1); 2.6708 (0.5); 2.6664 (0.4); 2.5238 (1.4); 2.5061 (71.3); 2.5018 (91.3); 2.4975 (65.1); 2.3330 (0.4); 2.3286 (0.5); 2.0571 (16.0); 1.9885 (0.8); 1.3976 (11.6); 1.1748 (0.4); 1.1309 (2.5); 1.1140 (4.9); 1.0967 (2.6); 0.0079 (1.9); -0.0002 (51.6); -0.0084 (2.0)</p>	N'-[5-хлор-2-метил-4-[(2-фенилфенил)метил]фенил]-N-этил-N-метилметанимидамид
26	1.53 ^[a] , 4.45 ^[b]	<p>Пример 26: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7010 (0.6); 7.2282 (0.5); 7.2199 (0.5); 7.2137 (0.6); 7.2065 (0.9); 7.2000 (0.6); 7.1927 (0.8); 7.1848 (0.7); 7.0002 (2.0); 6.9797 (1.6); 6.9035 (4.1); 6.8754 (0.4); 6.8648 (4.0); 6.8571 (1.9); 6.8503 (1.6); 6.7849 (1.0); 5.7567 (0.4); 3.7833 (16.0); 3.7761 (6.4); 3.3364 (0.7); 3.3230 (8.6); 2.9744 (0.8); 2.9100 (2.0); 2.5097 (6.0); 2.5055 (12.3); 2.5010 (16.4); 2.4966 (11.8); 2.4924 (5.7); 2.1333 (11.0); 1.3971 (0.6); 1.1431 (1.5); 1.1255 (3.1); 1.1079 (1.6); -0.0002 (8.5)</p>	N'-[2-хлор-4-[(2-метоксифенил)метил]-5-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид

27	1.61 ^[a] ; 4.70 ^[b]	<p>Пример 27: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.6897 (0.9); 7.5799 (0.3); 7.2897 (1.7); 7.2689 (3.7); 7.2579 (0.9); 7.2518 (3.5); 7.1758 (7.2); 7.1574 (5.7); 7.1505 (6.5); 7.1418 (0.8); 7.1387 (0.9); 6.7447 (1.4); 4.2427 (0.4); 4.2248 (1.6); 4.2069 (1.6); 4.1889 (0.5); 3.4202 (0.4); 3.4131 (0.4); 3.3221 (17.9); 2.9676 (1.1); 2.9082 (3.0); 2.5233 (0.4); 2.5099 (12.2); 2.5055 (25.4); 2.5011 (33.7); 2.4966 (23.9); 2.4923 (11.3); 2.1163 (16.0); 1.5051 (7.0); 1.4872 (7.0); 1.3973 (1.1); 1.1380 (2.8); 1.1203 (5.8); 1.1025 (2.8); 0.0079 (0.6); -0.0002 (18.3); -0.0086 (0.6)</p>	N'-[2-хлор-5-метил-4-(1-фенилэтил)фенил]-N-этил-N-метилметанимидамид
28	1.63 ^[a] ; 4.93 ^[b]	<p>Пример 28: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7254 (1.1); 7.6110 (0.4); 7.4875 (1.7); 7.4769 (1.3); 7.4729 (1.7); 7.4643 (2.2); 7.4542 (0.4); 7.2998 (0.5); 7.2894 (4.2); 7.2806 (2.9); 7.2753 (3.2); 7.2661 (4.0); 7.2565 (0.5); 7.0545 (1.6); 7.0455 (1.5); 7.0415 (1.3); 7.0311 (1.3); 6.8502 (6.0); 6.8354 (1.5); 3.9433 (8.7); 3.4196 (0.5); 3.3464 (1.0); 3.3243 (13.9); 2.9851 (1.3); 2.9165 (3.4); 2.5240 (0.4); 2.5064 (18.9); 2.5020 (24.4); 2.4976 (17.3); 2.1350 (16.0); 1.3971 (0.6); 1.1486 (2.0); 1.1312 (3.9); 1.1139 (2.1); 0.0078 (0.4); -0.0002 (10.8); -0.0086 (0.4)</p>	N'-[2-хлор-4-[(2-хлорфенил)метил]-5-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид
29	1.58 ^[a] ; 4.95 ^[b]	<p>Пример 29: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7263 (0.5); 7.2147 (0.5); 7.2056 (0.5); 7.2011 (0.7); 7.1933 (0.9); 7.1857 (0.6); 7.1801 (0.8); 7.1715 (0.7); 6.9889 (2.1); 6.9685 (1.6); 6.8819 (3.5); 6.8618 (0.9); 6.8546 (1.0); 6.8441 (4.7); 6.8354 (2.2); 6.8307 (2.0); 3.8692 (6.6); 3.7938 (16.0); 3.3438 (0.6); 3.3213 (14.8); 2.9739 (0.6); 2.9088 (1.6); 2.5236 (0.5); 2.5099 (14.2); 2.5057 (29.3); 2.5012 (39.0); 2.4968 (28.0); 2.4927 (13.6); 2.0829 (9.6); 1.1387 (1.4); 1.1213 (2.8); 1.1039 (1.5); -0.0002 (5.7)</p>	N'-[5-хлор-4-[(2-метоксифенил)метил]-2-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид

30	1.81 ^[a] ; 5.55 ^[b]	Пример 30: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.7501 (1.1); 7.6411 (0.6); 7.4724 (2.1); 7.4632 (2.1); 7.4579 (2.2); 7.4493 (2.6); 7.2827 (0.9); 7.2727 (5.1); 7.2640 (4.4); 7.2581 (4.5); 7.2494 (5.0); 7.2402 (0.7); 7.0383 (0.5); 7.0288 (2.1); 7.0197 (1.9); 7.0144 (1.8); 7.0052 (1.7); 6.9097 (1.6); 6.8677 (5.8); 4.0295 (11.5); 3.4165 (0.8); 3.3208 (229.2); 2.9798 (1.4); 2.9665 (0.9); 2.9146 (3.5); 2.6703 (3.1); 2.6100 (0.4); 2.5055 (412.8); 2.5012 (531.9); 2.4969 (384.4); 2.3279 (3.0); 2.0912 (16.0); 1.2330 (0.5); 1.1422 (2.4); 1.1267 (4.5); 1.1100 (2.7); 1.0875 (0.4); 0.1465 (0.5); 0.0078 (4.4); -0.0002 (118.1); -0.0083 (5.1); -0.1492 (0.5)	N'-[5-хлор-4-[(2-хлорфенил)метил]-2-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד
31	1.66 ^[a] ; 4.93 ^[b]	Пример 31: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.7789 (1.5); 7.6677 (0.7); 7.3558 (1.2); 7.3390 (3.7); 7.3204 (4.3); 7.3076 (2.4); 7.2908 (1.9); 7.2719 (0.6); 7.2484 (4.8); 7.2315 (3.5); 7.0846 (6.0); 6.8436 (1.9); 5.7855 (4.3); 5.1762 (4.3); 3.4620 (0.6); 3.4452 (0.8); 3.3665 (1.7); 3.3265 (170.4); 3.0056 (2.0); 2.9439 (4.9); 2.6711 (1.0); 2.5055 (136.5); 2.5016 (169.0); 2.4979 (131.0); 2.3281 (1.0); 1.8954 (16.0); 1.1638 (2.9); 1.1467 (5.9); 1.1290 (2.9); -0.0001 (2.2)	N'-[2-хлор-5-метил-4-(1-фенилэтен-1-ил)фенил]-N-этил-N-метилметанимидаמיד
32	1.46 ^[a] ; 4.34 ^[b]	Пример 32: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.7009 (0.4); 7.2062 (0.5); 7.2017 (0.6); 7.1829 (1.0); 7.1672 (0.7); 7.1629 (0.8); 6.9728 (1.6); 6.9528 (2.3); 6.9335 (1.3); 6.8575 (2.2); 6.8415 (1.7); 6.8392 (1.8); 6.8347 (1.5); 6.8231 (0.7); 6.8211 (0.7); 6.6329 (0.5); 6.6026 (0.5); 3.7854 (16.0); 3.7787 (5.8); 3.3232 (66.9); 2.9542 (0.5); 2.9073 (1.3); 2.5237 (0.7); 2.5187 (1.2); 2.5103 (17.9); 2.5059 (37.1); 2.5014 (49.4); 2.4969 (35.4); 2.4925 (17.2); 2.0728 (7.6); 1.9884 (0.8); 1.9433 (0.4); 1.3978 (4.2); 1.1746 (0.4); 1.1349 (1.5); 1.1173 (3.1); 1.0998 (1.6); -0.0002 (6.1)	N-этил-N'-[5-фтор-4-[(2-метоксифенил)метил]-2-метилфенил]-N-метилметанимидаמיד

33	1.41 ^[a] ; 4.37 ^[b]	<p>Пример 33: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.7033 (1.0); 7.6009 (0.4); 7.2818 (0.5); 7.2773 (0.5); 7.2680 (0.6); 7.2629 (1.3); 7.2435 (1.8); 7.2389 (1.2); 7.2300 (0.9); 7.2251 (1.0); 7.2041 (0.9); 7.1867 (2.1); 7.1676 (3.3); 7.1419 (2.3); 7.1336 (2.7); 7.1210 (1.6); 7.1153 (3.1); 7.0968 (1.2); 7.0943 (1.1); 6.9233 (2.8); 6.9012 (2.8); 6.6512 (1.0); 6.6229 (1.1); 4.0379 (0.4); 4.0203 (0.4); 3.8584 (9.1); 3.7610 (0.4); 3.4093 (0.5); 3.3210 (28.0); 2.9605 (1.2); 2.9058 (3.3); 2.6706 (0.3); 2.5102 (20.8); 2.5060 (41.4); 2.5015 (54.4); 2.4970 (39.4); 2.4928 (19.5); 2.0861 (16.0); 1.9886 (1.5); 1.9541 (0.7); 1.3974 (10.0); 1.1926 (0.4); 1.1748 (0.8); 1.1570 (0.5); 1.1330 (3.2); 1.1155 (6.2); 1.0980 (3.2); -0.0002 (6.9)</p>	<p>N-этил-N'-[5-фтор-4-[(2-фторфенил)метил]-2-метилфенил]-N-метилметанимидамид</p>
34	1.55 ^[a] ; 4.63 ^[b]	<p>Пример 34: ¹H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ= 7.6807 (0.9); 7.5811 (0.3); 7.2860 (1.8); 7.2668 (5.4); 7.2490 (6.0); 7.2248 (6.9); 7.2076 (3.0); 7.1740 (1.4); 7.1703 (1.9); 7.1666 (1.1); 7.1527 (3.0); 7.1388 (0.8); 7.1351 (1.3); 7.0449 (2.9); 7.0228 (2.9); 6.5861 (1.1); 6.5557 (1.1); 4.9435 (0.5); 4.2982 (0.6); 4.2804 (2.2); 4.2623 (2.2); 4.2440 (0.7); 3.4019 (0.5); 3.3192 (67.6); 2.9907 (0.3); 2.9211 (2.0); 2.9015 (3.0); 2.6744 (0.6); 2.6698 (0.8); 2.6654 (0.6); 2.5232 (2.0); 2.5097 (49.0); 2.5053 (101.8); 2.5009 (135.8); 2.4963 (98.5); 2.4920 (48.6); 2.3320 (0.6); 2.3275 (0.8); 2.3231 (0.6); 2.1170 (16.0); 1.9878 (1.3); 1.9838 (1.5); 1.5459 (9.9); 1.5277 (9.9); 1.4982 (0.9); 1.4799 (0.8); 1.3975 (8.1); 1.1743 (0.5); 1.1563 (0.4); 1.1275 (4.3); 1.1098 (8.2); 1.0921 (3.9); 0.0077 (0.5); -0.0004 (16.0); -0.0084 (0.7)</p>	<p>N-этил-N'-[5-фтор-2-метил-4-(1-фенилэтил)фенил]-N-метилметанимидамид</p>

35	1.52 ^[a] ; 4.54 ^[b]	Пример 35: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 7.7043 (1.0); 7.6008 (0.4); 7.3496 (0.4); 7.3287 (0.4); 7.2552 (0.8); 7.2338 (1.8); 7.2165 (1.9); 7.2103 (2.1); 7.2032 (1.4); 7.1949 (1.1); 7.1842 (1.8); 7.1790 (1.8); 7.1602 (1.2); 7.1539 (1.3); 7.0339 (1.0); 7.0286 (1.0); 7.0127 (1.9); 7.0074 (1.8); 6.9915 (0.9); 6.9862 (0.8); 6.9192 (2.8); 6.8969 (2.8); 6.6535 (1.0); 6.6234 (1.1); 3.8318 (8.6); 3.4124 (0.6); 3.3184 (55.2); 2.9622 (1.3); 2.9206 (2.2); 2.9055 (3.4); 2.6749 (0.7); 2.6703 (1.0); 2.6659 (0.7); 2.5234 (3.1); 2.5100 (61.0); 2.5058 (123.5); 2.5013 (163.4); 2.4968 (119.1); 2.4926 (59.3); 2.3327 (0.7); 2.3280 (1.0); 2.3235 (0.7); 2.1332 (1.6); 2.0877 (16.0); 1.9884 (0.8); 1.9548 (0.4); 1.3977 (3.2); 1.1747 (0.4); 1.1569 (0.4); 1.1334 (3.5); 1.1158 (6.3); 1.0984 (3.2); 0.1459 (0.9); 0.0078 (7.9); -0.0002 (199.2); -0.0084 (9.3); -0.1497 (0.9)	N'-[4-[(2,4-дифторфенил)метил]-5-фтор-2-метилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид
----	--	--	---

Значения LogP:

Измерение значений logP осуществляли в соответствии с Директивой ЕС 79/831/ЕЭС, Приложение V.A8 путем ВЭЖХ (высокоэффективная жидкостная хроматография) на колонках с обращенными фазами с использованием следующих методов:

- ^[a] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне использованием 0,1 % муравьиной кислоты в воде и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).
- ^[b] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в нейтральном диапазоне с использованием 0,001 молярного раствора ацетата аммония в воде и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

^[c] Значение LogP определяют посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне использованием 0,1 % фосфорной кислоты и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

Если в рамках одного и того же метода имеется несколько значений LogP, то приведены все значения, которые записаны через знак "+".

Калибровку осуществляли с использованием неразветвленных алкан-2-онов (с 3 - 16 атомами углерода) с известными значениями LogP (измерение значений LogP с использованием времени удержания с линейной интерполяцией между последовательными алканонами). Максимальные лямбда-значения определяли с использованием УФ-спектров от 200 нм до 400 нм и пиковых значений хроматографических сигналов.

Перечни пиков ЯМР

Данные ¹H-NMR выбранных соединений приведены в форме перечней пиков ¹H-NMR. Для каждого пика сигнала приводится значение δ в ppm, затем следует интенсивность сигнала в круглых скобках. Пары значение δ -интенсивность сигнала из различных пиков разделяют запятыми.

Таким образом, перечень пиков описан по следующей общей форме:

δ_1 (интенсивность₁), δ_2 (интенсивность₂), ..., δ_i (интенсивность_i),..., δ_n (интенсивность_n).

Интенсивность острых сигналов взаимосвязана с высотой (в см) сигналов в отпечатанном спектре NMR. В случае широких сигналов показано более одного пика или центр сигнала вместе с относительной интенсивностью в сравнении с наиболее интенсивным сигналом, показанным в спектре.

Для калибровки химического сдвига для ¹H спектров, мы использовали тетраметилсилан и/или химический сдвиг использовавшегося растворителя, в частности, в случае спектров, измерение которых осуществляли в DMSO. Таким образом, в перечнях пиков NMR могут появляться пики тетраметилсилана, но не обязательно.

Перечни пиков $^1\text{H-NMR}$ аналогичны классическим отпечаткам $^1\text{H-NMR}$ и, таким образом, обычно включают все пики, которые перечислены при классической NMR-интерпретации.

Дополнительно могут быть показаны, например, классические сигналы $^1\text{H-NMR}$ отпечатков растворителей, стереоизомеров целевых соединений, которые также являются целью изобретения, и/или пики примесей.

Для того чтобы показать сигналы соединений в дельта-диапазоне растворителей и/или воды показаны обычные пики растворителей, например, пики DMSO в DMSO- D_6 и пик воды в наших перечнях пиков $^1\text{H-NMR}$, которые обычно в среднем имеют высокую интенсивность.

Пики стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно в среднем имеют более низкую интенсивность, чем пики целевых соединений (например, с чистотой $>90\%$).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для определенных способов получения. Таким образом, их пики могут помочь исследовать воспроизведение способов получения по нашему изобретению с помощью "отпечатков пальцев побочных продуктов".

Настоящее изобретение будет проиллюстрировано далее следующими биологическими примерами. Однако изобретение не ограничивается этими примерами.

Пример: *in vivo* тест профилактического испытания на *Phakopsora* (соевые бобы)

Растворитель: 24.5 мас. частей ацетона

24.5 мас. частей диметилацетамида

Эмульгатор: 1 мас. часть алкиларилполигликолевого эфира

Для получения соответствующего препарата активного соединения 1 массовую часть активного соединения смешивают с определенными количествами растворителя и эмульгатора, и концентрат разбавляют водой до необходимой концентрации.

Для исследования профилактической активности молодые растения опрыскивают препаратом активного соединения при определенной дозе внесения. После того как покрытие, нанесенное опрыскиванием, высохло, растения инокулируют водной суспензией спор возбудителя ржавчины сои (*Phakopsora pachyrhizi*) и оставляют на 24 ч. без света в камере для инкубирования при температуре приблизительно 24 °С и относительной атмосферной влажности приблизительно 95%.

Растения оставили в камере для инкубирования при температуре приблизительно 24 °С и относительной атмосферной влажности приблизительно 80% и со световым периодом 12 ч.

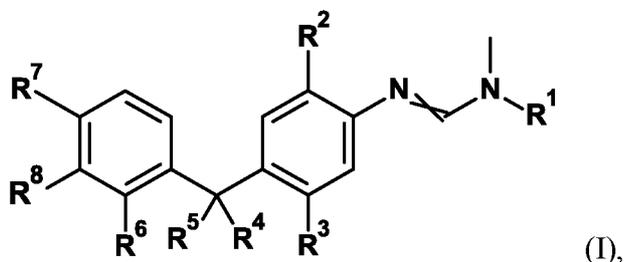
Тест оценивали через 7 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, которая соответствует эффективности необработанных контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что никакой болезни не наблюдается.

В данном тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность от 80% до 89% при концентрации 100 ч./млн. активного ингредиента: 1; 19

В данном тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность от 90% до 100% при концентрации 10 ч./млн. активного ингредиента: 2; 3; 6; 8; 9; 10; 11; 12; 13; 14; 18; 20; 21; 22; 23; 24; 30.

Формула изобретения

1. Соединения формулы (I)



в которой

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

R^2 и R^3 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C_2$ - C_8 -алкенила, $-C_2$ - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C_1 - C_8 -алкокси;

причем

R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C_1 - C_8 -алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 и R^8 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H , галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, C_3 - C_7 -циклоалкила, $-O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C_2$ - C_8 -алкенила, $-C_2$ - C_8 -алкинила, $-Si(R^{3a})(R^{3b})(R^{3c})$, $-C(O)$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)$ - C_3 - C_7 -циклоалкила, $-C(O)NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, $-C(O)O$ - C_1 - C_8 -алкила, $-S(O)_n$ - C_1 - C_8 -алкила, $-NH$ - C_1 - C_8 -алкила, $-N$ -ди- C_1 - C_8 -алкила, C_6 - C_{14} -арила, которые могут быть независимо не замещены или

замещены одной или более группами, выбранными из галогена, метила, галометила или C₁-C₈-алкокси;

причем R^{3a}, R^{3b}, R^{3c} представляют собой независимо друг от друга фенил или C₁-C₈-алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2;

или в которой R⁴ и R⁵ могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена, и причем R⁶, R⁷ и R⁸ имеют указанные выше значения;

или в которой R⁴ и R⁵ вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель =CR⁹R¹⁰, причем R⁹ и R¹⁰, каждый независимо выбран из группы, состоящей из H, галогена, Me и Et, и причем R⁶, R⁷ и R⁸ имеют указанные выше значения;

или их соли, N-оксиды, комплексы металлов и их стереоизомеры.

2. Соединения по п. 1, причем

R¹ выбран из группы, состоящей из C₁-C₈-алкила,

R² выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁-C₈-алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C₁-C₈-алкокси;

R³ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁-C₈-алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C₁-C₈-алкокси;

R⁴ и R⁵ выбраны из группы, состоящей из H, галогена, циано, C₁-C₈-алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена или C₁-C₈-алкокси;

или R⁴ и R⁵ могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или

гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H, F, Cl, Me и Et;

R^6 , R^7 и R^8 независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, циано, Me, метокси, фенила и фенила, замещенного одним или более заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, Me и CF_3 .

3. Соединения по одному из пп. 1 или 2, причем

R^1 выбран из группы, состоящей из Me, Et, iPr;

R^2 выбран из группы, состоящей из Me, циано, Cl, Br, I, CHF_2 , CF_3 ;

R^3 выбран из группы, состоящей из Me, Циано, F, Cl, Br, I;

R^4 и R^5 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H;

или R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, или с дополнительными атомами, выбранными из N, O, P и S, 3-7-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила или гетероциклила, которые могут быть, при необходимости, замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

R^6 выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F;

R^7 и R^8 представляют собой H.

4. Соединения по п. 1 или 2, причем

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_8 -алкила,

R^2 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

R^3 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

R^4 и R^5 выбраны из группы, состоящей из H, галогена, циано, C_1 - C_8 -алкила, которые могут быть независимо не замещены или замещены одной или более группами, выбранными из галогена;

или R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, 3-6-членное кольцо, выбранное из группы, состоящей из циклоалкила, который может быть, при необходимости, замещен одной или более группами, выбранными из галогена;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CR^9R^{10}$, причем R^9 и R^{10} , каждый независимо выбран из группы, состоящей из водорода, Me и Et;

R^6 , R^7 и R^8 независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, циано, Me, метокси и фенила.

5. Соединения по одному из пп. 1, 2 или 4, причем

R^1 выбран из группы, состоящей из Me, Et, iPr;

R^2 выбран из группы, состоящей из Me, циано, Cl, Br, I, CHF_2 , CF_3 ;

R^3 выбран из группы, состоящей из Me, iPr, Циано, F, Cl, Br, I;

R^4 и R^5 , каждый независимо выбран из группы, состоящей из H и Me;

или R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, циклопропил, который может быть, при необходимости, замещен одной или более группами, выбранными из группы, состоящей из F, Cl и Br;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

R^6 выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F, Cl, метокси и фенила;

R^7 выбран из группы, состоящей из H и F, и

R^8 выбран из группы, состоящей из H и F.

6. Соединения по одному из пп. 1, 2, 4 или 5, причем

R^1 выбран из группы, состоящей из Et и *i*Pr;

R^2 выбран из группы, состоящей из Me и Cl;

R^3 выбран из группы, состоящей из Me, F и Cl;

R^4 выбран из группы, состоящей из H и Me, и

R^5 представляет собой H;

или R^4 и R^5 могут образовывать вместе с атомом, с которым они связаны, циклопропил, который может быть, при необходимости, замещен одним или двумя F;

или в которой R^4 и R^5 вместе могут образовывать соединенный двойной связью заместитель $=CH_2$;

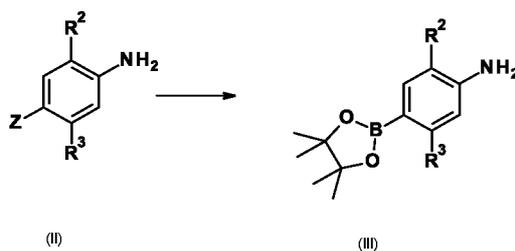
R^6 выбран из группы, состоящей из H, Me, циано, F и Cl;

R^7 выбран из группы, состоящей из H и F, и

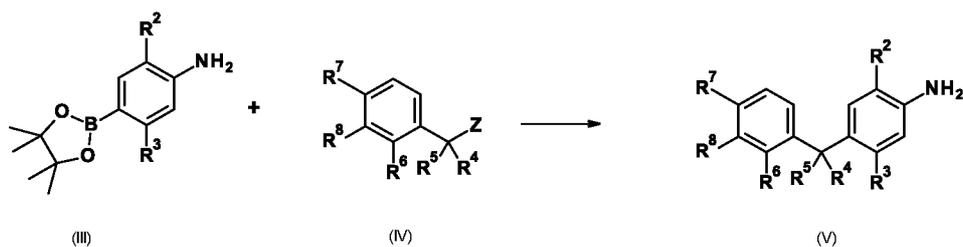
R^8 выбран из группы, состоящей из H и F.

7. Способ получения соединения по одному из пп. 1 - 6, который включает, по меньшей мере, один из следующих этапов (a) - (g):

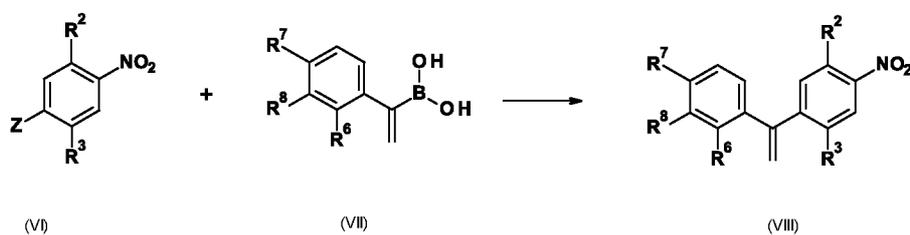
(a) реакцию производных анилинов формулы (II) с получением производных формулы (III) в соответствии со схемой реакции ниже:



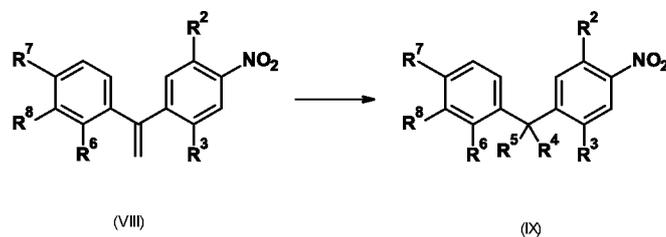
(b) реакцию производных формулы (III) с производными бензила формулы (IV) с получением производных формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



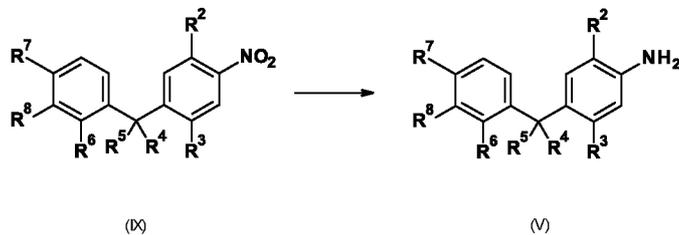
- (c) реакцию сочетания производных нитробензола формулы (VI) с бороновыми кислотами или сложными эфирами формулы (VII) с получением производных алкенила формулы (VIII) в соответствии со схемой реакции ниже:



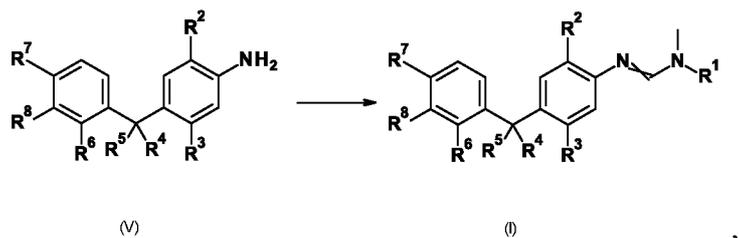
- (d) реакцию производных алкенила формулы (VIII) с получением производных циклопропила формулы (IX) в соответствии со схемой реакции ниже:



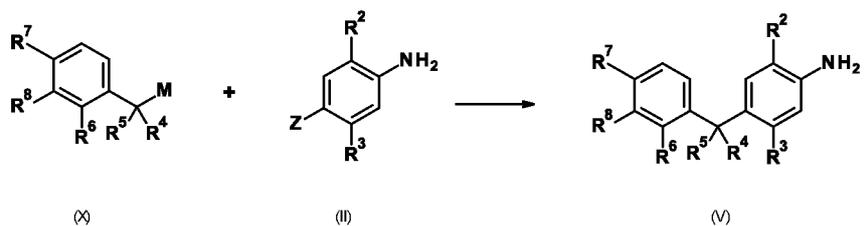
- (e) сокращение производных нитробензола формулы (IX) до производных анилина формулы (V) в соответствии со схемой реакции ниже:



- (f) реакцию анилинов формулы (V) с аминоацетальями с получением амидинов формулы (I) в соответствии со схемой ниже:



(g) реакцию металлоорганического соединения формулы (X) с производными анилина формулы (II) с выходом анилинов формулы (V) в соответствии со схемой ниже:



где в вышеуказанных схемах

Z выбран из группы, состоящей из Cl, Br, I и OSO_2CF_3 ;

M выбран из группы, состоящей из MgZ и ZnZ ;

$\text{R}^1 - \text{R}^8$ имеют значения, как в любом из пп. 1 - 6.

8. Композиция, содержащая соединение по одному из пп. 1 - 6 и дополнительно содержащая вспомогательные вещества, растворители, носители, поверхностно-активные вещества или разбавители.

9. Применение соединения по одному из пп. 1 - 6 или композиции по п. 8 для борьбы с фитопатогенными грибами.

10. Способ борьбы с фитопатогенными грибами при защите растений, отличающийся тем, что соединение по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8 наносят на фитопатогенные грибы и/или место их произрастания.

11. Семена, содержащие соединение по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8.

12. Применение соединения по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8 для обработки семян.

13. Применение соединения по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8 для обработки трансгенных растений.

14. Применение соединения по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8 для обработки семян трансгенных растений.

15. Способ защиты семян от фитопатогенных грибов с помощью использования семян, содержащих, по меньшей мере, соединение по одному из пп. 1 - 6 или композицию по п. 8.