

ГАЛУЗЬ ВІНАХОДУ

Даний винахід стосується 3-заміщених феніламідинових сполук. Більш конкретно даний винахід стосується 3-заміщених феніламідинових сполук загальної формули (I), способу їх одержання та їх застосування як засобу для захисту культур.

ПЕРЕДУМОВИ ВІНАХОДУ

Патогенні гриби продовжують становити серйозну загрозу здоров'ю населення та сільському господарству. Отже, контроль хвороб рослин, спричинених грибовими патогенами рослин, надзвичайно важливий для досягнення високої продуктивності культур. Хвороби рослин, що уражають декоративні, овочеві, польові, злакові та плодові культури, можуть зумовлювати значне зниження урожайності та, таким чином, призводити до підвищення вартості для споживача. Додатково до того, що вони часто є вкрай шкідливими, хвороби рослин можуть важко піддаватися контролю, а також може розвиватися стійкість до комерційних фунгіцидів. Для даних цілей на ринку доступно багато продуктів, але залишається актуальною потреба у нових фунгіцидних сполуках, які є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, більш безпечними для зовнішнього середовища або характеризуються відмінними зонами дії.

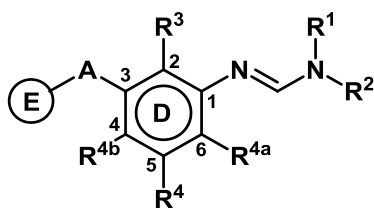
Наприклад, у WO2000046184, WO2003024219, WO2005089547, WO2003093224, WO2007031507 розкриті похідні феніламідину та їх застосування як фунгіцидів або окремо, або як частина композиції.

Ефективність похідних феніламідину, описаних у рівні техніки, є доброю, але в різних випадках є недостатньою. Тому в сільському господарстві завжди викликає велику зацікавленість використання нових пестицидних сполук для уникнення та/або контролю розвитку мікроорганізмів, таких як патогенні гриби або бактерії, або шкідників, стійких до відомих активних інгредієнтів. Із цього випливає, що велику зацікавленість викликає використання нових сполук, які є більш активними за вже відомі сполуки, з метою зниження кількостей активної сполуки, що необхідно використати, водночас зі збереженням ефективності, що є щонайменше еквівалентною ефективності вже відомих сполук.

На сьогодні екологічні та економічні вимоги щодо фунгіцидів безупинно підвищуються, наприклад щодо спектра активності, токсичності, селективності, норми застосування, утворення залишків та сприятливих способів виготовлення, та також збільшується частота виникнення, наприклад, проблем щодо стійкості, отже, існує постійна потреба в одержанні нових фунгіцидних сполук, які перевершають такі екологічні та економічні вимоги та/або зменшать проблеми, пов'язані зі стійкістю патогенів. Відповідно, у даному винаході представлена нова родина сполук, які характеризуються наявністю вказаних вище ефектів або переваг, таким чином забезпечуючи несподівану та у значній мірі вищу активність щодо небажаних мікроорганізмів, таких як грибові або бактеріальні патогени.

СТИСЛИЙ ОПИС ВІНАХОДУ

Відповідно, у даному винаході представлена 3-заміщена феніламідинова сполука загальної формули (I) або її прийнятні з погляду сільського господарства солі, структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи або N-оксиди.



Формула (I),

де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{4a} , R^{4b} , A та E є такими, як визначено в докладному описі.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб одержання сполуки загальної формули (I) або її прийнятної з погляду сільського господарства солі.

В іншому варіанті здійснення у даному винаході представлена композиція, що містить щонайменше одну сполуку загальної формули (I) та необов'язково щонайменше одну іншу активну сполуку, вибрану із фунгіцидів, інсектицидів, нематодцидів, акарицидів, біопестицидів, гербіцидів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, добрив та/або їх сумішей.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлене застосування сполук формули (I) та композицій на їхній основі для контролю та/або попередження фітопатогенних мікроорганізмів сільськогосподарських культур та/або садових культур.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлені застосування щонайменше однієї сполуки за даним винаходом у комбінаціях або композиціях та способи їх застосування, зокрема в галузі сільського господарства, загалом для захисту рослин.

Сполуки за даним винаходом характеризуються підвищеною активністю щодо мікроорганізмів, зокрема щодо фітопатогенних грибів. Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в галузі сільського господарства або можна застосовувати як проміжні сполуки для здійснення синтезу сполук, що мають більш широкі варіанти застосування.

ДОКЛАДНИЙ ОПИС ВІНАХОДУ

ВИЗНАЧЕННЯ

Наступні визначення, представлені для термінології, застосовуваної в даному винаході, призначені лише для ілюстративних цілей та ніяк не обмежують обсяг даного винаходу, розкритого в даному описі.

Перехідна фраза "містить", "що містить", "включає", "що включає", "має", "що має", "містить", "що містить", "характеризується" або будь-які інші їхні варіації призначені для охоплення невиключного включення, якщо інше не передбачене будь-якими очевидно вказаними обмеженнями. Наприклад, композиція, суміш, процес або

спосіб, які включають список елементів, необов'язково обмежені тільки цими елементами, а й можуть включати інші елементи, явно не перераховані або не властиві такій композиції, суміші, процесу або способу.

Перехідна фраза "що складається з" виключає будь-який не вказаний елемент, стадію або інгредієнт. Якщо така фраза присутня в пункті формули, вона обмежує включення матеріалів, відмінних від перерахованих, за винятком домішок, зазвичай з ними пов'язаних. Якщо фраза "що складається з" з'являється у реченні відмітної частини пункту формули винаходу, а не безпосередньо після обмежувальної частини, вона обмежує тільки елемент, вказаний у цьому реченні; інші елементи не виключаються з пункту формули в цілому.

Перехідну фразу "що по суті складається з" застосовують для визначення композиції або способу, які включають матеріали, стадії, риси, компоненти або елементи додатково до тих, що буквально розкриті, за умови, що такі додаткові матеріали, стадії, риси, компоненти або елементи суттєво не впливають на основну(-і) та нову(-і) характеристику(-и) заявленого винаходу. Термін "що по суті складається з" займає середню позицію між "що містить" та "що складається з".

Крім того, якщо явно не вказано протилежне, "або" стосується включного "або", а не виключного "або". Наприклад, умова "А" або "В" задовольняється будь-чим із наступного: А істинне (або наявне) та В хибне (або відсутнє), А хибне (або відсутнє) та В істинне (або наявне), й А та В обидва істинні (або наявні).

Крім того, елемент або компонент у формі однини за даним винаходом призначені для необмежувального числа випадків (тобто появ) елемента або компонента. Отже, форми однини слід читати як такі, що включають один або щонайменше один, та слово у формі однини, що позначає елемент або компонент, також включає множину, якщо кількість явно не означає однину.

Як згадується у даному розкритті, термін "пестицид" також завжди у кожному випадку включає термін "засіб для захисту сільськогосподарських культур".

Термін "небажані мікроорганізми" або "фітопатогенні мікроорганізми", такі як грибові або бактеріальні патогени, включає конкретно *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* та *Deuteromycetes* і *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* та *Streptomyetaceae* відповідно.

Термін "агрономічний" стосується виробництва польових культур, як, наприклад, для продуктів харчування, видів палива, видів біопалива, будь-яких біоматеріалів та волокон, і включає конкретно вирощування кукурудзи, соєвих бобів та інших бобових, рису, злакових культур (наприклад, пшениці, вівса, ячменю, жита, рису, маїсу), листових овочів (наприклад, салату-латуку, капусти та інших капустяних культур), плодоносних овочів (наприклад, помідорів, перцю, баклажанів, хрестоцвітих та гарбузових), видів картоплі, видів солодкої картоплі, видів винограду, бавовнику, плодів дерев (наприклад, сім'янок, кістянок та цитрусових), ягідних культур (ягід, вишень), культур для виробництва біопалива, таких як кукурудза, цукрові/крохмальні культури, цукровий буряк та солодке сорго, культур для одержання целюлози, таких як просо лозоподібне, міскантус, кукурудзяна солома, тополя, культур рапсу (канолі) для одержання біопалива, соєвих бобів, пальмової олії, гірчиці, рижю, сафлору, соняшнику та ятрофи й інших спеціальних культур (наприклад, канолі, соняшнику, оливки).

Термін "неагрономічний" стосується культур, відмінних від польових культур, таких як садові культури (наприклад, тепличні рослини, саджанці або декоративні рослини, які не вирощують на полях), варіантів застосування в житлових, сільськогосподарських, комерційних та промислових структурах, дернині (наприклад, деревна ферма, пасовище, поле для гольфу, галявина, спортивний майданчик тощо), виробках із деревини, продуктах, які зберігаються, агролісівництві та управлінні рослинністю, охороні здоров'я населення (тобто людини) та охороні здоров'я тварин (наприклад, одомашнених тварин, таких як домашні тварини, домашня худоба та домашня птиця, неодомашнених тварин, таких як дикі тварини).

Терміни "алкільна", "алкенільна", "алкінільна", "карбоциклільна", "гетероциклільна", "арильна" та "гетероарильна" групи, визначені у даному документі, необов'язково заміщені (наприклад, "заміщена" або "незаміщена" алкільна, "заміщена" або "незаміщена" алкенільна, "заміщена" або "незаміщена" алкінільна, "заміщена" або "незаміщена" карбоциклільна, "заміщена" або "незаміщена" гетероциклільна, "заміщена" або "незаміщена" арильна або "заміщена" або "незаміщена" гетероарильна група). Загалом термін "заміщений", незалежно від того, чи йому передуює "необов'язково" чи ні, означає, що щонайменше один водень, присутній у групі (наприклад, атом вуглецю або атом азоту тощо), замінений допустимим замісником, наприклад замісником, який у результаті заміщення зумовлює утворення стійкої сполуки, наприклад сполуки, яка не зазнає спонтанного перетворення, як, наприклад, шляхом перегрупування, циклізування, відщеплення або іншої реакції в нормальних умовах (температура, тиск, повітря тощо). Якщо не вказане інше, "заміщена" група містить замісник при одному або більше заміщених положеннях групи, та якщо більше ніж одне положення в будь-якій вказаній структурі заміщене, замісник є або однаковим, або відмінним при кожному одноженні.

Термін "алкіл", застосовуваний або окремо, або в складних словах, таких як "алкілтіо" або "галогеналкіл", включає C₁-C₂₄алкіл із прямим або розгалуженим ланцюгом, переважно C₁-C₁₅алкіл, більш переважно C₁-C₁₀алкіл, найбільш переважно C₁-C₆алкіл. Необмежувальні приклади алкілу включають метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутіл, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутіл, 2-метилбутіл, 3-метилбутіл, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутіл, 1,2-диметилбутіл, 1,3-диметилбутіл, 2,2-диметилбутіл, 2,3-диметилбутіл, 3,3-диметилбутіл, 1-етилбутіл, 2-етилбутіл, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл або інші ізомери. Якщо алкіл знаходиться в кінці складного замісника, як, наприклад, в алкілциклоалкілі, то частина складного замісника на початку, наприклад циклоалкіл, може бути моно- або полізаміщеною однаково або по-різному та незалежно алкілом. Це також стосується складних замісників, у яких на кінці знаходяться інші радикали, наприклад алкеніл, алкініл, гідроксил, галоген, карбоніл, карбонілокси тощо.

Термін "алкеніл", застосовуваний або окремо, або в складних словах, включає C₂-C₂₄алкени з розгалуженим або прямим ланцюгом, переважно C₂-C₁₅алкени, більш переважно C₂-C₁₀алкени, найбільш переважно C₂-

С₆алкени. Необмежувальні приклади алкенів включають етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1, 1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1, 1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл та інші ізомери. "Алкеніл" також включає полієни, такі як 1,2-пропадієніл та 2,4-гексадієніл. Дане визначення також стосується алкенілу як частини складного замісника, наприклад галогеналкенілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "алкініл", застосовуваний або окремо, або в складних словах, включає C₂-C₂₄алкіни з розгалуженим або прямим ланцюгом, переважно C₂-C₁₅алкіни, більш переважно C₂-C₁₀алкіни, найбільш переважно C₂-C₆алкіни. Необмежувальні приклади алкінів включають етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1, 2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-бутиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл та 1-етил-1-метил-2-пропініл та інші ізомери. Дане визначення також стосується алкінілу як частини складного замісника, наприклад галогеналкінілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше. "Алкініл" також може включати фрагменти, що містять декілька потрійних зв'язків, такі як 2,5-гексадіїніл.

Термін "циклоалкіл" означає алкіл, замкнений з утворенням кільця. Необмежувальні приклади включають без обмеження циклопропіл, циклобутил, циклопентил та циклогексил. Дане визначення також стосується циклоалкілу як частини складного замісника, наприклад циклоалкілалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "циклоалкеніл" означає алкеніл, замкнений з утворенням кільця, включаючи моноциклічні, частково ненасичені вуглеводневі групи. Необмежувальні приклади включають без обмеження циклопентеніл та циклогексеніл. Дане визначення також стосується циклоалкенілу як частини складного замісника, наприклад циклоалкенілалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "циклоалкініл" означає алкініл, замкнений з утворенням кільця, включаючи моноциклічні, частково ненасичені групи. Дане визначення також стосується циклоалкінілу як частини складного замісника, наприклад циклоалкінілалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Терміни "циклоалкокси", "циклоалкенілокси" тощо визначені аналогічно. Необмежувальні приклади циклоалкокси включають циклопропілокси, циклопентилокси та циклогексилокси. Дане визначення також стосується циклоалкокси як частини складного замісника, наприклад циклоалкоксиалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "алкокси", застосовуваний або окремо, або в складних словах, включає C₁-C₂₄алкокси, переважно C₁-C₁₅алкокси, більш переважно C₁-C₁₀алкокси, найбільш переважно C₁-C₆алкокси. Необмежувальні приклади алкокси включають метокси, етокси, пропокси, 1-метилетокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилетокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-етилпропокси, гексокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-етилбутокси, 2-етилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-етил-1-метилпропокси та 1-етил-2-метилпропокси та інші ізомери. Дане визначення також стосується алкокси як частини складного замісника, наприклад галогеналкокси, алкінілалкокси тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "алкілтіо" включає алкілтіо-фрагменти з розгалуженим або прямим ланцюгом, такі як метилтіо, етилтіо, пропілтіо, 1-метилетилтіо, бутилтіо, 1-метилпропілтіо, 2-метилпропілтіо, 1,1-диметилетилтіо, пентилтіо, 1-метилбутилтіо, 2-метилбутилтіо, 3-метилбутилтіо, 2,2-диметилпропілтіо, 1-етилпропілтіо, гексилтіо, 1,1-диметилпропілтіо, 1,2-диметилпропілтіо, 1-метилпентилтіо, 2-метилпентилтіо, 3-метилпентилтіо, 4-метилпентилтіо, 1,1-диметилбутилтіо, 1,2-диметилбутилтіо, 1,3-диметилбутилтіо, 2,2-диметилбутилтіо, 2,3-диметилбутилтіо, 3,3-диметилбутилтіо, 1-етилбутилтіо, 2-етилбутилтіо, 1,1,2-триметилпропілтіо, 1,2,2-триметилпропілтіо, 1-етил-1-метилпропілтіо та 1-етил-2-метилпропілтіо та інші ізомери.

Необмежувальні приклади "алкілсульфінілу" включають без обмеження метилсульфініл, етилсульфініл, пропілсульфініл, 1-метилетилсульфініл, бутилсульфініл, 1-метилпропілсульфініл, 2-метилпропілсульфініл, 1,1-диметилетилсульфініл, пентилсульфініл, 1-метилбутилсульфініл, 2-метилбутилсульфініл, 3-метилбутилсульфініл, 2,2-диметилпропілсульфініл, 1-етилпропілсульфініл, гексилсульфініл, 1,1-диметилпропілсульфініл, 1,2-диметилпропілсульфініл, 1-метилпентилсульфініл, 2-метилпентилсульфініл, 3-метилпентилсульфініл, 4-метилпентилсульфініл, 1,1-диметилбутилсульфініл, 1,2-диметилбутилсульфініл, 1,3-диметилбутилсульфініл, 2,2-диметилбутилсульфініл, 2,3-диметилбутилсульфініл, 3,3-диметилбутилсульфініл, 1-етилбутилсульфініл, 2-етилбутилсульфініл, 1,1,2-триметилпропілсульфініл, 1,2,2-триметилпропілсульфініл, 1-етил-1-метилпропілсульфініл та 1-етил-2-метилпропілсульфініл та інші ізомери. Термін "арилсульфініл" включає

Ar-S(O), де Ar може являти собою будь-який карбоцикл або гетероцикл. Дане визначення також стосується алкілсульфонілу як частини складного замісника, наприклад галогеналкілсульфонілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Необмежувальні приклади "алкілсульфонілу" включають без обмеження метилсульфоніл, етилсульфоніл, пропілсульфоніл, 1-метилетилсульфоніл, бутилсульфоніл, 1-метилпропілсульфоніл, 2-метилпропілсульфоніл, 1,1-диметилетилсульфоніл, пентилсульфоніл, 1-метилбутилсульфоніл, 2-метилбутилсульфоніл, 3-метилбутилсульфоніл, 2,2-диметилпропілсульфоніл, 1-етилпропілсульфоніл, гексилсульфоніл, 1,1-диметилпропілсульфоніл, 1,2-диметилпропілсульфоніл, 1-метилпентилсульфоніл, 2-метилпентилсульфоніл, 3-метилпентилсульфоніл, 4-метилпентилсульфоніл, 1,1-диметилбутилсульфоніл, 1,2-диметилбутилсульфоніл, 1,3-диметилбутилсульфоніл, 2,2-диметилбутилсульфоніл, 2,3-диметилбутилсульфоніл, 3,3-диметилбутилсульфоніл, 1-етилбутилсульфоніл, 2-етилбутилсульфоніл, 1,1,2-триметилпропілсульфоніл, 1,2,2-триметилпропілсульфоніл, 1-етил-1-метилпропілсульфоніл та 1-етил-2-метилпропілсульфоніл та інші ізомери. Термін "арилсульфоніл" включає Ar-S(O)₂, де Ar може являти собою будь-який карбоцикл або гетероцикл. Дане визначення також стосується алкілсульфонілу як частини складного замісника, наприклад алкілсульфонілалкілу тощо, якщо де-небудь не вказане інше.

Термін "гідрокси" означає -OH, "аміно" означає -NRR, де R може являти собою H або будь-який можливий замісник, такий як алкіл; "карбоніл" означає -C(O)-, "карбонілокси" означає -OC(O)-, "сульфоніл" означає SO₂.

Термін "галоген" або окремо, або в складному слові, такому як "галогеналкіл", включає фтор, хлор, бром або йод. Крім того, під час використання в складних словах, таких як "галогеналкіл", вказаний алкіл може бути частково або повністю заміщений атомами галогену, які можуть бути однаковими або різними.

Необмежувальні приклади "галогеналкілу" включають хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-брометил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил, 1,1-дихлор-2,2,2-трифторетил та 1,1,1-трифторпроп-2-іл. Дане визначення також стосується галогеналкілу як частини складного замісника, наприклад галогеналкіламіноалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Терміни "галогеналкеніл" та "галогеналкініл" визначені аналогічно за винятком того, що замість алкільних груп присутні алкенільні та алкінільні групи як частини замісника.

Термін "галогеналкокси" означає алкоксигрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, де деякі або всі атоми водню в таких групах можуть бути замінені атомами галогену, вказаними вище. Необмежувальні приклади галогеналкокси включають хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 1-хлоретокси, 1-брометокси, 1-фторетокси, 2-фторетокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2-хлор-2-фторетокси, 2-хлор-2,2-дифторетокси, 2,2-дихлор-2-фторетокси, 2,2,2-трихлоретокси, пентафторетокси та 1,1,1-трифторпроп-2-окси. Дане визначення також стосується галогеналкокси як частини складного замісника, наприклад галогеналкоксиалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "галогеналкілтіо" або "галогеналкілсульфаніл" означає алкілтіогрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, де деякі або всі атоми водню в таких групах можуть бути замінені атомами галогену, вказаними вище. Необмежувальні приклади галогеналкілтіо включають хлорметилтіо, бромметилтіо, дихлорметилтіо, трихлорметилтіо, фторметилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, хлорфторметилтіо, дихлорфторметилтіо, хлордифторметилтіо, 1-хлоретилтіо, 1-брометилтіо, 1-фторетилтіо, 2-фторетилтіо, 2,2-дифторетилтіо, 2,2,2-трифторетилтіо, 2-хлор-2-фторетилтіо, 2-хлор-2,2-дифторетилтіо, 2,2-дихлор-2-фторетилтіо, 2,2,2-трихлоретилтіо, пентафторетилтіо та 1,1,1-трифторпроп-2-ілтіо. Дане визначення також стосується галогеналкілтіо як частини складного замісника, наприклад галогеналкілтіоалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Приклади "галогеналкілсульфонілу" включають CF₃S(O), CCl₃S(O), CF₃CH₂S(O) та CF₃CF₂S(O). Приклади "галогеналкілсульфонілу" включають CF₃S(O)₂, CCl₃S(O)₂, CF₃CH₂S(O)₂ та CF₃CF₂S(O)₂.

Термін "біциклічне кільце або кільцева система" позначає кільцеву систему, що складається з двох або більше спільних атомів.

Термін "ароматичний" вказує на те, що правило Гюккеля задовольняється, та термін "неароматичний" вказує на те, що правило Гюккеля не задовольняється.

Терміни "карбоцикл", або "карбоциклічний", або "карбоцикліл" включають "ароматичну карбоциклічну кільцеву систему" та "неароматичну карбоциклічну кільцеву систему" або поліциклічні або біциклічні (спіро, конденсовані, з'єднані містковим зв'язком, неконденсовані) кільцеві сполуки, у яких кільце може бути ароматичним або неароматичним (де "ароматичний" вказує на те, що правило Гюккеля задовольняється, та "неароматичний" вказує на те, що правило Гюккеля не задовольняється).

Необмежувальні приклади неароматичної карбоциклічної кільцевої системи являють собою циклопропіл, циклобутил, цикlopентил, норборніл тощо.

Необмежувальні приклади ароматичної карбоциклічної кільцевої системи являють собою феніл, нафтил тощо.

Термін "арил", застосовуваний у даному документі, являє собою групу, що містить будь-яку ароматичну групу на основі вуглецю, включаючи без обмеження феніл, нафталін, біфеніл, антрацен тощо. Арильна група може бути заміщеною або незаміщеною. Окрім цього, арильна група може являти собою окрему кільцеву структуру або складатися з декількох кільцевих структур, які є конденсованими кільцевими структурами або приєднаними за допомогою однієї або більше груп, що утворюють місток, як, наприклад, вуглець-вуглецевий зв'язок.

Термін "аралкіл" стосується арильних вуглеводневих радикалів, що включають алкільну складову, визначену вище. Необмежувальні приклади включають бензил, фенілетил та 6-нафтилгексил. Застосовуваний у даному

документі термін "аралкеніл" стосується арильних вуглеводневих радикалів, що включають алкенільну складову, визначену вище, та арильну складову, визначену вище. Необмежувальні приклади включають стирил, 3-(бензил)-проп-2-еніл та 6-нафтилгекс-2-еніл.

Термін "гетеро" у поєднанні з кільцями стосується кільця, в якому щонайменше один атом кільця не є вуглецем, і який може містити 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з групи, що складається з азоту, кисню і сірки, за умови, що кожне кільце містить не більше ніж 4 атоми азоту, не більше ніж 2 атоми кисню і не більше ніж 2 атоми сірки.

Термін "гетероцикл" або "гетероциклічний" включає "ароматичний гетероцикл" або "гетероарильну кільцеву систему" та "неароматичну гетероциклічну кільцеву систему" або поліциклічні або біциклічні (спіро, конденсовані, з'єднані містковим зв'язком, неконденсовані) кільцеві сполуки, в яких кільце може бути ароматичним або неароматичним, де гетероциклічне кільце містить щонайменше один гетероатом, вибраний із N, O, S(O)₀₋₂, та/або член кільця, що являє собою C, гетероциклу може бути замінений C(=O), C(=S), C(=CR*R*) та C=NR*, при цьому * позначає цілі числа.

Термін "неароматичний гетероцикл" або "неароматична гетероциклічна сполука" означає три – п'ятнадцяти-членний, переважно три – дванадцяти-членний, насичений або частково ненасичений гетероцикл, що містить один – чотири гетероатоми з групи, що складається з кисню, азоту та сірки, моно-, бі- або трициклічні гетероцикли, які додатково до членів кільця, що являють собою атоми вуглецю, містять один – три атоми азоту та/або один атом кисню або сірки або один або два атоми кисню та/або сірки; при цьому якщо кільце містить більше ніж один атом кисню, вони не є безпосередньо суміжними; наприклад (без обмеження), оксираніл, азиридиніл, оксетаніл, азетидиніл, тіетаніл, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротієніл, 3-тетрагідротієніл, 1-піролідиніл, 2-піролідиніл, 3-піролідиніл, 3-ізоксазолідиніл, 4-ізоксазолідиніл, 5-ізоксазолідиніл, 3-ізотіазолідиніл, 4-ізотіазолідиніл, 5-ізотіазолідиніл, 1-піразолідиніл, 3-піразолідиніл, 4-піразолідиніл, 5-піразолідиніл, 2-оксазолідиніл, 4-оксазолідиніл, 5-оксазолідиніл, 2-тіазолідиніл, 4-тіазолідиніл, 5-тіазолідиніл, 1-імідазолідиніл, 2-імідазолідиніл, 4-імідазолідиніл, 1,2,4-оксадіазолідин-3-іл, 1,2,4-оксадіазолідин-5-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-3-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-5-іл, 1,2,4-тріазолідин-1-іл, 1,2,4-тріазолідин-3-іл, 1,3,4-оксадіазолідин-2-іл, 1,3,4-тіадіазолідин-2-іл, 1,3,4-тріазолідин-1-іл, 1,3,4-тріазолідин-2-іл, 2,3-дигідрофур-2-іл, 2,3-дигідрофур-3-іл, 2,4-дигідрофур-2-іл, 2,4-дигідрофур-3-іл, 2,3-дигідротієн-2-іл, 2,3-дигідротієн-3-іл, 2,4-дигідротієн-2-іл, 2,4-дигідротієн-3-іл, піролініл, 2-піролін-2-іл, 2-піролін-3-іл, 3-піролін-2-іл, 3-піролін-3-іл, 2-ізоксазолін-3-іл, 3-ізоксазолін-3-іл, 4-ізоксазолін-3-іл, 2-ізоксазолін-4-іл, 3-ізоксазолін-4-іл, 4-ізоксазолін-4-іл, 2-ізоксазолін-5-іл, 3-ізоксазолін-5-іл, 4-ізоксазолін-5-іл, 2-ізотіазолін-3-іл, 3-ізотіазолін-3-іл, 4-ізотіазолін-3-іл, 2-ізотіазолін-4-іл, 3-ізотіазолін-4-іл, 4-ізотіазолін-4-іл, 2-ізотіазолін-5-іл, 3-ізотіазолін-5-іл, 4-ізотіазолін-5-іл, 2,3-дигідропіразол-1-іл, 2,3-дигідропіразол-2-іл, 2,3-дигідропіразол-3-іл, 2,3-дигідропіразол-4-іл, 2,3-дигідропіразол-5-іл, 3,4-дигідропіразол-1-іл, 3,4-дигідропіразол-3-іл, 3,4-дигідропіразол-4-іл, 3,4-дигідропіразол-5-іл, 4,5-дигідропіразол-1-іл, 4,5-дигідропіразол-3-іл, 4,5-дигідропіразол-4-іл, 4,5-дигідропіразол-5-іл, 2,3-дигідрооксазол-2-іл, 2,3-дигідрооксазол-3-іл, 2,3-дигідрооксазол-4-іл, 2,3-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 3,4-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, піперидиніл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, піразиніл, морфолініл, тіоморфолініл, 1,3-діоксан-5-іл, 2-тетрагідропіраніл, 4-тетрагідропіраніл, 2-тетрагідротієніл, 3-гексагідропіридазиніл, 4-гексагідропіридазиніл, 2-гексагідропіримідиніл, 4-гексагідропіримідиніл, 5-гексагідропіримідиніл, 2-піперазиніл, циклосерини. Дане визначення також стосується гетероциклілу як частини складного замісника, наприклад гетероциклілалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "гетероарил" означає 5- або 6-членну, повністю ненасичену моноциклічну кільцеву систему, що містить один – чотири гетероатоми з групи, що складається з кисню, азоту та сірки; при цьому якщо кільце містить більше ніж один атом кисню, вони не є безпосередньо суміжними; 5-членний гетероарил, що містить один – чотири атоми азоту або один – три атоми азоту та один атом сірки або кисню: 5-членні гетероарильні групи, які додатково до атомів вуглецю можуть містити один – чотири атоми азоту або один – три атоми азоту та один атом сірки або кисню як члени кільця, наприклад (без обмеження) фурил, тієніл, піроліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піразоліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,2,4-тріазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,3,4-тріазоліл, тетразоліл; азот-зв'язаний 5-членний гетероарил, що містить один – чотири атоми азоту, або бензоконденсований азот-зв'язаний 5-членний гетероарил, що містить один – три атоми азоту: 5-членні гетероарильні групи, які додатково до атомів вуглецю можуть містити один – чотири атоми азоту або один – три атоми азоту як члени кільця та в яких два суміжні члени кільця, що являють собою вуглець, або один азот та один суміжний член кільця, що являє собою вуглець, можуть бути зв'язані містковим зв'язком за допомогою бута-1,3-дієн-1,4-діїльної групи, в якій один або два атоми вуглецю можуть бути замінені атомами азоту, де такі кільця приєднані до скелета за допомогою одного з членів кільця, що являють собою азот, наприклад (без обмеження) 1-піроліл, 1-піразоліл, 1,2,4-тріазоліл, 1-імідазоліл, 1,2,3-тріазоліл та 1,3,4-тріазоліл;

6-членний гетероарил, який містить один – чотири атоми азоту: 6-членні гетероарильні групи, які додатково до атомів вуглецю можуть містити, відповідно, один – три та один – чотири атоми азоту як члени кільця, наприклад (без обмеження) 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-тріазин-2-іл, 1,2,4-тріазин-3-іл та 1,2,4,5-тетразин-3-іл; бензоконденсований 5-членний гетероарил, що містить один – три атоми азоту або один атом азоту та один атом кисню або сірки, наприклад (без обмеження), індол-1-іл, індол-2-іл, індол-3-іл, індол-4-іл, індол-5-іл, індол-6-іл, індол-7-іл, бензімідазол-1-іл, бензімідазол-2-іл, бензімідазол-4-іл, бензімідазол-5-іл, індазол-1-іл, індазол-3-іл, індазол-4-іл, індазол-5-іл, індазол-6-іл, індазол-7-іл, індазол-2-іл, 1-бензофуран-2-іл, 1-бензофуран-3-іл, 1-бензофуран-4-іл, 1-бензофуран-5-іл, 1-бензофуран-6-іл, 1-бензофуран-7-іл, 1-бензотіофен-2-іл, 1-бензотіофен-3-іл, 1-бензотіофен-4-іл, 1-бензотіофен-5-іл, 1-бензотіофен-6-іл, 1-бензотіофен-7-іл, 1,3-бензотіазол-2-іл, 1,3-бензотіазол-4-іл, 1,3-бензотіазол-5-іл, 1,3-бензотіазол-6-іл, 1,3-бензотіазол-7-іл, 1,3-бензоксазол-2-іл, 1,3-бензоксазол-4-іл, 1,3-бензоксазол-5-іл, 1,3-бензоксазол-6-іл та 1,3-бензоксазол-7-іл; бензоконденсований 6-

членний гетероарил, який містить один – три атоми азоту, наприклад (без обмеження), хінолін-2-іл, хінолін-3-іл, хінолін-4-іл, хінолін-5-іл, хінолін-6-іл, хінолін-7-іл, хінолін-8-іл, ізохінолін-1-іл, ізохінолін-3-іл, ізохінолін-4-іл, ізохінолін-5-іл, ізохінолін-6-іл, ізохінолін-7-іл та ізохінолін-8-іл.

Необмежувальні приклади конденсованого 6-5-членного гетероарилу включають індолізініл; піразоло[1,5-а]піридиніл; імідазо[1,2-а]піридиніл; піроло[1,2-а]піримідиніл; піразоло[1,5-а]піримідиніл; імідазо[1,2-а]піримідиніл; піроло[1,2-а]піразиніл; піразоло[1,5-а]піразиніл; імідазо[1,2-а]піразиніл тощо.

Дане визначення також стосується гетероарилу як частини складного замісника, наприклад гетероарилалкілу тощо, якщо де-небудь конкретно не вказане інше.

Термін "амід" означає $A-R'C=ONR''-B$, де R' та R'' позначають замісники, й A та B позначають будь-яку групу.

Термін "тіоамід" означає $A-R'C=SNR''-B$, де R' та R'' позначають замісники, й A та B позначають будь-яку групу.

Термін "група, що відходить" означає всі замісники, які характеризуються достатньою нуклеофільністю в переважних умовах реакції, або групу, здатну до нуклеофільної заміни; як приклад, як придатні групи, що відходять, можуть бути вказані галогени, трифлат, мезилат, тозилат або SO_2-Me .

Загальне число атомів вуглецю в групі-заміснику вказують за допомогою префікса " C_i-C_j ", де i та j являють собою числа від 1 до 21. Наприклад, C_1 -Сзалкілсульфоніл позначає метилсульфоніл – пропілсульфоніл; C_2 алкоксиалкіл позначає CH_3OCH_2 ; C_3 алкоксиалкіл позначає, наприклад, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ або $CH_3CH_2OCH_2$; та C_4 алкоксиалкіл позначає різноманітні ізомери алкільної групи, заміщені алкоксигрупою, що містить загалом чотири атоми вуглецю, приклади включають $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ та $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. Згідно з вищевикладеним, якщо сполука формули I складається з одного або більше гетероциклічних кілець, усі замісники приєднуються до даних кілець за допомогою будь-якого доступного атома вуглецю або азоту шляхом заміни водню при вказаному атомі вуглецю або азоту.

Якщо сполука заміщена замісником із вказаним нижнім індексом, який вказує на те, що число вказаних замісників може перевищувати 1, вказані замісники (якщо вони перевищують 1) незалежно вибрані з групи, що складається з визначених замісників. Крім того, якщо нижній індекс m в $(R)_m$ позначає ціле число, що перебуває у діапазоні від, наприклад, 0 до 4, то число замісників може бути вибране із цілих чисел від 0 до 4 включно.

Якщо група містить замісник, який може являти собою водень, то вважається, що вказана група незаміщена, якщо даний замісник приймається за водень.

Варіанти здійснення, описані у даному документі, та їхні різноманітні риси та переважні деталі пояснюються з посиланням на необмежувальні варіанти здійснення в описі. Описи широко відомих компонентів та методик обробки опущені, щоб надмірно не перешкоджати розумінню варіантів здійснення, описаних у даному документі. Приклади, застосовувані у даному документі, призначені лише для полегшення розуміння способів, за допомогою яких варіанти здійснення, описані у даному документі, можна реалізовувати на практиці, та додатково для забезпечення можливості для фахівців у даній галузі реалізовувати на практиці варіанти здійснення, описані у даному документі. Відповідно, приклади не слід розуміти як такі, що обмежують обсяг варіантів здійснення, описаних у даному документі.

Вищевказаний опис конкретних варіантів здійснення буде настільки повно розкривати основну суть варіантів здійснення, описаних у даному документі, що інші можуть шляхом застосування сучасних знань легко модифікувати та/або адаптувати такі конкретні варіанти здійснення для різноманітних застосувань без відступу від загальної концепції, та, отже, такі адаптації та модифікації слід розуміти в межах значення та діапазону еквівалентів розкритих варіантів здійснення, та вони призначені для такого розуміння. Слід розуміти, що формулювання або термінологія, використовувані у даному документі, призначені для опису, а не для обмеження. Отже, хоча варіанти здійснення, наведені у даному документі, були описані в контексті переважних варіантів здійснення, фахівці у даній галузі зрозуміють, що варіанти здійснення, наведені у даному документі, можна реалізовувати на практиці з модифікацією в межах сутності та обсягу варіантів здійснення, описаних у даному документі.

Будь-яке згадування документів, актів, матеріалів, пристроїв, статей тощо, які були включені в даний опис, здійснюється лише для цілі представлення контексту для даного винаходу. Не мається на увазі, що будь-які або всі такі матеріали утворюють частину основи рівня техніки або були загальновідомими в галузі техніки, якої стосується даний винахід, оскільки вони були десь відомими до дати пріоритету даної заявки.

Числові значення, вказані в описі та вищевказаних пунктах формули, хоча і можуть становити важливу частину даного винаходу за даним описом, будь-які відхилення від таких числових значень все ще будуть знаходитись у межах обсягу даного винаходу, якщо відхилення дотримується такого ж наукового принципу, як і в даному винаході, розкритому в даному описі.

Термін "шкідник" для цілі даного винаходу включає без обмеження гриби, страменофіти (оомицети), бактерії, нематоди, кліщі, іксодових кліщів, комах та гризунів.

Термін "рослина" в даному документі слід розуміти як такий, що означає всі рослини та популяції рослин, такі як бажані та небажані дикі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини, що зустрічаються в природі). Культурні рослини можуть являти собою рослини, які можна одержувати за допомогою способів традиційної селекції та оптимізації або за допомогою способів біотехнології та генетичної інженерії або комбінацій таких способів, включаючи трансгенні рослини та включаючи культурні сорти рослин, які охороняються та не охороняються правами селекціонерів.

Для цілі даного винаходу термін "рослина" включає живий організм, прикладом якого є дерева, кущі, лікарські трави, трави, папороті та мохи, які типово ростуть на ділянці, поглинають воду та необхідні речовини через їхні корені та синтезують поживні речовини у своєму листі шляхом фотосинтезу.

Приклади "рослини" для цілі даного винаходу включають без обмеження сільськогосподарські культури, такі як пшениця, жито, ячмінь, тритикале, овес або рис; буряк, наприклад цукровий буряк або кормовий буряк; плоди та плоди дерева, такі як сім'янки, кістянки або ягоди, наприклад види яблука, груші, сливи, персика, мигдалю,

вишні, суниці, малини, ожини або агрусу; бобові рослини, такі як види сочевиці, гороху, люцерна або соєві боби; олійні рослини, такі як ріпак, гірчиця, види оливков, соняшника, кокос, какао-боби, рицина, олійні пальми, земляні горіхи або соєві боби; гарбузові, такі як види кабачка, огірок або види дині; волокнисті рослини, такі як бавовник, льон, коноплі або джут; цитрусові плоди та цитрусові дерева, такі як види апельсина, лимона, грейпфрута або мандарина; будь-які садові рослини, овочі, такі як шпинат, салат-латук, спаржа, види капусти, моркви, цибулі, томата, картоплі, гарбуза або паприка; лаврові рослини, такі як види авокадо, кориця або камфора; рослини з родини гарбузових; олійні рослини; рослини для одержання енергії та сировини, такі як злакові культури, кукурудза, соя, інші бобові рослини, ріпак, цукрова тростина або олійна пальма; тютюн; горіхи; кавове дерево; чайна рослина; дерево какао; бананові дерева; види перцю; виткі рослини (столові сорти винограду та виноградні лози для одержання виноградного соку); хміль; дернина; солодкий лист (також називаний стевією); рослини для одержання природного каучуку або декоративні та лісові рослини, такі як квіти, кущі, широколисті дерева або вічнозелені рослини, наприклад хвойні; та матеріал для розмноження рослин, такий як насіння, та вирощений матеріал таких рослин.

Переважно рослина для цілей даного винаходу включає без обмеження злакові культури, кукурудзу, рис, сою та інші бобові рослини, плоди та плодові дерева, види винограду, горіхи та горіхові дерева, цитрусові та цитрусові дерева, будь-які садові рослини, рослини з родини гарбузових, олійні рослини, тютюн, кавове дерево, чайну рослину, дерево какао, цукровий буряк, цукрову тростину, бавовник, картоплю, томат, види цибулі, види перцю та овочі, декоративні рослини, будь-які квітникарські рослини та інші рослини для застосування людиною та тваринами.

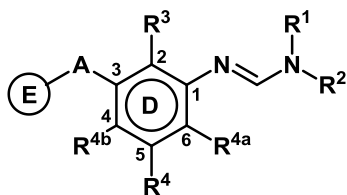
Термін "частини рослини" слід розуміти як такий, що означає всі частини та органи рослин, які знаходяться над та під землею. Для цілі даного винаходу термін "частини рослини" включає без обмеження живці, листки, гілки, коренеплоди, квіти, насіння, гілля, корені, включаючи стрижневі корені, бічні корені, кореневі волоски, кореневий апекс, кореневий чохлак, кореневища, саджанці, пагони, плоди, плодові тіла, кору, стебло, бруньки, бічні бруньки, меристеми, вузли та міжвузля.

Термін "місце їхнього зростання" включає ґрунт, навколишнє середовище рослини або частин рослини та обладнання або інструменти, застосовувані до, під час або після посіву/посадки рослини або частини рослини.

Застосування сполук за даним винаходом або сполуки за даним винаходом у композиції, що необов'язково містить інші сумісні сполуки, щодо рослини або рослинного матеріалу або місця її зростання включає застосування за допомогою методики, відомої фахівцю у даній галузі, яке включає без обмеження розпилення, нанесення покриття, занурення, обкурювання, просочування, вприскування та напилування.

Термін "застосований" означає прилипання до рослини або частини рослини або фізично, або хімічно, включаючи за допомогою просочування.

Із погляду на вищевказане у даному винаході представлена сполука загальної формули (I),



Формула (I),

де

R¹ вибраний із групи, що складається з водню, ціано, C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, C₁-C₁₂алкокси, C₃-C₈циклоалкілу та C₄-C₈циклоалкілалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S);

R² вибраний із групи, що складається з C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, (C=O)-R" та C₃-C₈циклоалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S); або

R¹ та R² разом з атомами, до яких вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C, N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S), можуть утворювати три – семичленне неароматичне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X, CN, R', OR', SR', N(R')₂, COOR' та CON(R')₂;

кожна група R¹ та R² необов'язково може бути заміщена однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X, CN, R', OR', SR', N(R')₂, COOR' та CON(R')₂;

R³ вибраний із групи, що складається з X, ціано, C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, N(R'R''), OR'', S(O)_nR'', (C=O)-R" та C₃-C₈циклоалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S);

R⁴ вибраний із групи, що складається з X, ціано, C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, N(R'R''), OR'', S(O)_nR'', (C=O)-R", C₃-C₈циклоалкілу та C₇-C₁₂аралкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклічному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S);

R^{4a} та R^{4b} незалежно вибрані з групи, що складається з водню, X, ціано, C₁-C₄алкілу, C₂-C₄алкенілу, C₂-C₄алкінілу, C₁-C₄галогеналкілу, OR'', S(O)_nR' та C₃-C₅циклоалкілу;

кожна група R^3 та R^4 необов'язково може бути заміщена однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

А являє собою $\{[C(R^6R^7)]_{0-2}(B)_{0-1}\}$, $\{[B-C(R^6R^7)]_{0-1}-C(=Y)\}$; де B являє собою O , S , NR^5 або CR^6R^7 ; та Y являє собою O або S ;

R^5 вибраний із групи, що складається з водню, C_1 - C_8 алкілу, C_2 - C_8 алкенілу, C_2 - C_8 алкінілу, C_1 - C_8 галогеналкілу, $S(O)_nR''$, OR'' , $NR''R''$, $(C=O)-R''$ та C_3 - C_8 циклоалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$, $C(=S)$;

R^6 та R^7 незалежно вибрані з групи, що складається з водню, X , ціано, C_1 - C_8 алкілу, C_2 - C_8 алкенілу, C_2 - C_8 алкінілу, C_1 - C_8 галогеналкілу, $N(R'')_2$, OR'' , $(C=O)-R''$ та C_3 - C_8 циклоалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$; або

R^6 та R^7 разом з атомом, до якого вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C , N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$, можуть утворювати три – шестичленне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

кожна група R^5 , R^6 та R^7 може необов'язково бути заміщена однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

кільце E вибране з групи, що складається з конденсованих або неконденсованих C_3 - C_{18} карбоциклілу та C_3 - C_{18} гетероциклілу, які необов'язково можуть бути заміщені однією або більше групами R^8 ;

R^8 вибраний із групи, що складається з водню, X , ціано, нітро, C_1 - C_{12} алкілу, C_2 - C_{12} алкенілу, C_2 - C_{12} алкінілу, C_1 - C_{12} галогеналкілу, C_2 - C_{12} галогеналкенілу, C_2 - C_{12} галогеналкінілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, C_4 - C_8 циклоалкенілу, C_4 - C_8 циклоалкінілу, C_7 - C_{19} аралкілу, C_5 - C_{12} біциклоалкілу, C_6 - C_{10} арилу, C_3 - C_6 гетероциклілу, SCN , SF_5 , $N(R'R'')$, OR'' , $S(O)_nR'''$, $(C=O)-R'''$, C_1 - C_8 -алкіл- $S(O)_nR''$, C_1 - C_8 -алкіл- $(C=O)-R''$, $CR'=NR''$, $-S(R^9)=N(R^{10})$, $-S(R^9)(O)=N(R^{10})$, $S(R^9)_2=N$, $S(R^9)_2(O)=N$ та $S(R^9)_2(O)=N-C(R^{6a}R^{7a})$; де один або більше атомів вуглецю в циклічному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$;

R^{6a} та R^{7a} незалежно вибрані з групи, що складається з водню, X , ціано, C_1 - C_8 алкілу, C_2 - C_8 алкенілу, C_2 - C_8 алкінілу, C_1 - C_8 галогеналкілу, C_2 - C_8 галогеналкенілу, $(NR'')_2$, OR'' , $S(O)_nR'''$, $(C=O)-R''$ та C_3 - C_8 циклоалкілу; або

R^{6a} та R^{7a} разом з атомом, до якого вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C , N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$, можуть утворювати три – шестичленне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$; або

R^{6a} та R^{7a} разом з атомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати групу $=O$ або $=S$;

R^9 незалежно вибраний із групи, що складається з C_1 - C_8 алкілу та C_3 - C_8 циклоалкілу;

R^{10} вибраний із групи, що складається з водню, ціано, C_1 - C_8 -алкілу, C_2 - C_8 алкенілу, C_2 - C_8 алкінілу, $(C=O)-R''$, $S(O)_nR'''$ та C_3 - C_8 циклоалкілу; або

R^9 та R^{10} разом з атомом, до якого вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C , N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$, можуть утворювати три – семичленне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$; або

R^8 та R^9 або R^{10} разом з атомом, до якого вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C , N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$, можуть утворювати три – семичленне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

R^5 , або R^6 , або R^7 та R^8 , або два R^8 разом з атомом, до якого вони приєднані, або разом із додатковими атомами, вибраними з групи, що складається з C , N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$, можуть утворювати три – десятичленне кільце, яке, зі свого боку, може бути заміщене однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

кожна група R^8 , R^9 або R^{10} необов'язково може бути заміщена однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R'R'')$, $COOR'$ та $CON(R'R'')$;

X являє собою галоген;

R' вибраний із групи, що складається з водню, C_1 - C_8 алкілу та C_3 - C_8 циклоалкілу; де алкільна та циклоалкільна групи необов'язково можуть бути заміщені одним або більше X ;

R'' вибраний із групи, що складається з водню, C_1 - C_8 алкілу, C_1 - C_8 галогеналкілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, $N(R')_2$, OR' та C_6 - C_{18} арилу; де один або більше атомів вуглецю в циклічному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$;

R''' вибраний із груп, що складаються з ціано, R'' , C_2 - C_8 алкенілу, C_2 - C_8 алкінілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, C_4 - C_8 циклоалкенілу, C_4 - C_8 циклоалкінілу, OR' , $(C=O)-R'$, $COOR'$, $CON(R')_2$, C_6 - C_{18} арилу та C_7 - C_{19} аралкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклічному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N , O , $S(O)_m$, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з $C(=O)$ або $C(=S)$;

кожна група R'' та R''' може бути заміщена однією або більше групами, вибраними з групи, що складається з X , CN , R' , OR' , SR' , $N(R')_2$, $COOR'$ та $CON(R')_2$;

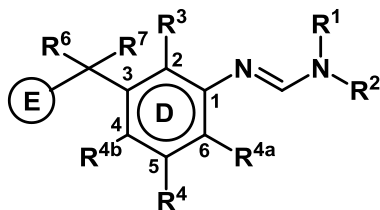
n являє собою ціле число 0, 1 або 2;

m являє собою ціле число 0, 1 або 2;

або її прийнятні з погляду сільського господарства солі, ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереоізомери, енантіомери, таутомери, поліморфи, комплекси з металами або N-оксиди;

за умови, що наступні сполуки виключені з визначення сполуки формули (I); N'-(2-ціано-3-((3,3-дифтор-1-метилпіперидин-4-іл)окси)-5-метоксифеніл)-N,N-диметилформімідаміду та N'-(5-бром-2-ціано-3-((2,4-диметоксибензил)окси)феніл)-N,N-диметилформімідаміду.

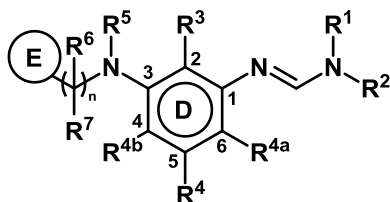
В іншому варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (Ia),



Формула (Ia),

де R¹, R², R³, R⁴, R^{4a}, R^{4b}, R⁶, R⁷ та E є такими, як визначено вище.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (Ib та Ic),

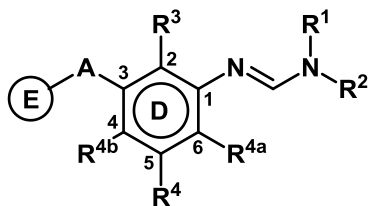


n=0 (Ib); n=1 (Ic)

Формула (Ib/Ic),

де R¹, R², R³, R⁴, R^{4a}, R^{4b}, R⁵, R⁶, R⁷ та E є такими, як визначено вище.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (Id та Ie),

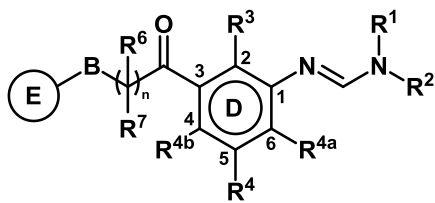


A=O (Id); A=S (Ie)

Формула (Id/Ie),

де R¹, R², R³, R⁴, R^{4a}, R^{4b}, A та E є такими, як визначено вище.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (If та Ig),



n = 0 (If); n = 1 (Ig)

Формула (If/Ig),

де R¹, R², R³, R⁴, R^{4a}, R^{4b}, R⁶, R⁷, B та E є такими, як визначено вище.

У переважному варіанті здійснення даного винаходу у даному винаході представлена сполука формули (I), де R¹ вибраний із групи, що складається з C₁-C₆алкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆алкокси, C₃-C₅циклоалкілу та C₄-C₈циклоалкілалкілу;

R² вибраний із групи, що складається з C₁-C₆алкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₃-C₈циклоалкілу та C₁-C₆галогеналкілу;

R³ та R⁴ незалежно вибрані з групи, що складається з X, ціано, C₁-C₆алкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆галогеналкілу, N(R'''), OR'', S(O)_nR''', (C=O)-R'' та C₃-C₈циклоалкілу;

R⁵ вибраний із групи, що складається з водню, C₁-C₆алкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₃-C₈циклоалкілу та OR'';

R⁶ та R⁷ незалежно вибрані з групи, що складається з водню, X, ціано, C₁-C₄алкілу, C₂-C₄алкенілу, C₂-

С₄алкінілу, С₁-С₄галогеналкілі та С₃-С₄циклоалкілі; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1–3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) або C(=S);

кільце E вибране з групи, що складається з конденсованих або неконденсованих С₃-С₁₀карбоциклілу та С₅-С₁₀гетероциклілу, які можуть необов'язково бути заміщені однією або більше групами R⁸;

або її прийнятні з погляду сільського господарства солі, ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи або N-оксиди.

У більш переважному варіанті здійснення даного винаходу у даному винаході представлена сполука формули (I), де

R¹ та R² незалежно вибрані з групи, що складається з С₁-С₆алкілу, С₂-С₆алкенілу, С₃-С₅циклоалкілу та С₄-С₈циклоалкілалкілу;

R³ та R⁴ незалежно вибрані з групи, що складається з Х, ціано, С₁-С₆алкілу, С₂-С₆алкенілу, С₂-С₆алкінілу, С₁-С₆галогеналкілі, С₃-С₅циклоалкілі та OR⁺;

R⁵ вибраний із групи, що складається з водню, С₁-С₆алкілу, С₂-С₆алкенілу, С₂-С₆алкінілу, С₁-С₆галогеналкілі, С₃-С₅циклоалкілі та OR⁺;

R⁶ та R⁷ незалежно вибрані з групи, що складається з водню, Х, ціано, С₁-С₄алкілу, С₂-С₄алкенілу, С₂-С₄алкінілу, С₁-С₄галогеналкілі, OR⁺ та С₃-С₅циклоалкілі;

кільце E вибране з циклопропілу, циклобутилу, фенілу, нафталенілу, фурилу, тієнілу, піролілу, ізоксазолілу, тіазолілу, ізотіазолілу, тіадіазолілу, піразолілу, оксазолілу, імідазолілу, оксадіазолілу, триазолілу, піридинілу, піридазинілу, піримідинілу, піразинілу, триазинілу, індолілу, бензимидазолілу, індазолілу, бензофуранілу, бензотіофенілу, бензотіазолілу, бензоксазолілу, хінолінілу, ізохінолінілу, хіназолінілу, цинонілу, індолізинілу, піразоло[1,5-а]піридинілу, імідазо[1,2-а]піридинілу, піроло[1,2-а]піримідинілу, піразоло[1,5-а]піримідинілу, імідазо[1,2-а]піримідинілу, піроло[1,2-а]піразинілу, піразоло[1,5-а]піразинілу, імідазо[1,2-а]піразинілу; де кожний замісник в E необов'язково заміщений одним або більше R⁸;

або її прийнятні з погляду сільського господарства солі, ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи або N-оксиди.

У переважному варіанті здійснення сполука формули (I) вибрана з групи, що складається з N'-(2-хлор-5-метил-3-(п-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2,5-диметил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(3-(3-хлорбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2,5-диметил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(3-(3-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(3-((2-фторфеніл)аміно)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(3-((2-фторфеніл)(метил)аміно)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(феніламіно)феніл)-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(феніламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(метил(феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(2-хлорбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(2-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(о-толіламіно)феніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((4-(трифторметил)тіо)феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-3-((2-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідаміду, N'-(3-((4-(трет-бутил)феніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(3-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((2-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(о-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(3-((4-(трет-бутил)феніл)аміно)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(4-((трифторметил)тіо)феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(3-хлорбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(3-метоксибензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-3-((3-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-3-((3-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(м-толіламіно)феніл)-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-фтор-3-((3-фторфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідаміду, N'-(3-((3-хлорфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((3-хлорфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((3-хлорфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((3-хлорфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((3-метоксифеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(метил(м-толіл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(4-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(4-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(2-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(3-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-((3-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(4-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-5-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(2-хлор-3-(3-хлор-4-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду,

[illegible]

[illegible]

[illegible]

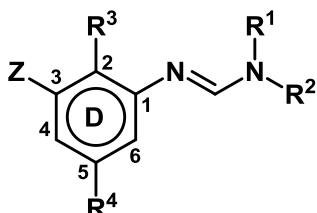
(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідаміду, N'-(3-(3-ціанобензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N-етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідаміду, N'-(3-бензил-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(5-ціано-3-(3-ціанобензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(5-ціано-3-(4-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(3-(4-хлорбензил)-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(5-ціано-2-метил-3-(3-нітробензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду, N'-(3-(3-бромбензил)-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду та N'-(5-ціано-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду.

Будь-яка зі сполук згідно з даним винаходом може існувати в одній або більше оптичних, геометричних або хіральних ізомерних формах залежно від кількості асиметричних центрів у сполучі. Тому даний винахід стосується однаковою мірою всіх оптичних ізомерів та їх рацемічних або скалемічних сумішей (термін "скалемічна" означає суміш енантіомерів у різних пропорціях), а також сумішей усіх можливих стереоізомерів у всіх пропорціях. Діастереомери та/або оптичні ізомери можуть бути розділені згідно зі способами, відомими per se фахівцю в даній галузі.

Будь-яка зі сполук згідно з даним винаходом також може існувати в одній або більше геометричних ізомерних формах залежно від кількості подвійних зв'язків у сполучі. Тому даний винахід стосується однаковою мірою всіх геометричних ізомерів та всіх можливих сумішей в усіх пропорціях. Геометричні ізомери можуть бути розділені згідно із загальними способами, відомими per se фахівцю в даній галузі техніки.

Будь-яка зі сполук згідно з даним винаходом також може існувати в одній або більше з аморфних, або ізоморфних, або поліморфних форм залежно від їх одержання, очищення, зберігання та ряду інших факторів впливу. Тому даний винахід стосується всіх можливих аморфних, ізоморфних і поліморфних форм в усіх пропорціях. Аморфні, ізоморфні та поліморфні форми можуть бути одержані, та/або розділені, та/або очищені згідно із загальними способами, відомими per se фахівцю в даній галузі техніки.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (A);



Формула (A),

де

Z являє собою OH, NH₂, SH, X або групу, що відходить;

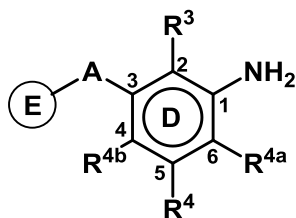
R¹ вибраний із групи, що складається з C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу та C₃-C₈циклоалкілу;

R² вибраний із групи, що складається з ціано, C₂-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, (C=O)-R'', C₃-C₈циклоалкілу та C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₃алкілу;

R³ вибраний із групи, що складається з X, ціано, C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, N(R'R''), OR'', S(O)_nR''', (C=O)-R'' та C₃-C₈циклоалкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклоалкільному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1-3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) та C(=S);

R⁴ вибраний із групи, що складається з X, ціано, C₁-C₁₂алкілу, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂галогеналкілу, N(R'R''), OR'', S(O)_nR''', (C=O)-R'', C₃-C₈циклоалкілу та C₇-C₁₂аралкілу; де один або більше атомів вуглецю в циклічному кільці можуть бути замінені гетероатомами, вибраними з групи, що складається з N, O, S(O)_m, та необов'язково з включенням 1-3 членів кільця, вибраних із групи, що складається з C(=O) та C(=S).

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлена сполука формули (B);



Формула (B),

де R³, R⁴, R^{4a}, R^{4b}, A та E є такими, як визначено вище.

У переважному варіанті здійснення сполука формули (B) вибрана з 2-хлор-5-метил-N¹-(п-толіл)бензол-1,3-діаміну, 2,5-диметил-3-(4-метилбензил)аніліну, 3-(3-хлорбензил)-2,5-диметиланіліну, 2,5-диметил-3-(2-метилбензил)аніліну, 3-(3-фторбензил)-2,5-диметиланіліну, N¹-(2-фторфеніл)-2,5-диметилбензол-1,3-діаміну, N¹-(2-фторфеніл)-N¹,2,5-триметилбензол-1,3-діаміну, 5-фтор-2-метил-N¹-фенілбензол-1,3-діаміну, 2-хлор-5-метил-N¹-фенілбензол-1,3-діаміну, 2-хлор-N¹,5-диметил-N¹-фенілбензол-1,3-діаміну, 5-фтор-N¹,2-диметил-N¹-фенілбензол-1,3-діаміну, 2-хлор-5-метил-3-(2-метилбензил)аніліну, 2-хлор-3-(2-хлорбензил)-5-метиланіліну, 2-хлор-3-(2-фторбензил)-5-метиланіліну, 5-фтор-2-метил-N¹-(о-толіл)бензол-1,3-діаміну, 5-фтор-2-метил-N¹-(4-((трифторметил)тіо)феніл)бензол-1,3-діаміну, 2-хлор-5-метил-3-(3-метилбензил)аніліну, 2-хлор-5-метил-3-(4-метилбензил)аніліну, 5-фтор-N¹-(2-фторфеніл)-2-метилбензол-1,3-діаміну, N¹-(4-(трет-бутил)феніл)-5-фтор-2-

[illegible]

[illegible]

1,3-діаміну, 2-хлор-N¹,5-диметил-N¹-(6-(трифторметил)піридин-2-іл)бензол-1,3-діаміну, 5-фтор-N¹,2-диметил-N¹-(6-(трифторметил)піридин-2-іл)бензол-1,3-діаміну, 3-(3-фтор-5-метилбензил)-5-метокси-2-метиланіліну, 3-(2-хлор-5-фторбензил)-5-метокси-2-метиланіліну, 3-(2-бромбензил)-5-метокси-2-метиланіліну, 5-метокси-2-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)аніліну, 5-метокси-2-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)аніліну, 3-аміно-5-(3-фторбензил)-4-метилбензонітрилу, 3-бензил-5-метокси-2-метиланіліну, 5-метокси-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)аніліну, 5-метокси-2-метил-N¹-(2-(трифторметокси)феніл)бензол-1,3-діаміну, 5-хлор-2-метил-N¹-(2-(трифторметокси)феніл)бензол-1,3-діаміну, 2-хлор-5-метил-N¹-(2-(трифторметокси)феніл)бензол-1,3-діаміну, 5-фтор-2-метил-N¹-(2-(трифторметокси)феніл)бензол-1,3-діаміну, 1-(3-аміно-5-фтор-2-метилфеніл)-2-(2-хлор-4-метоксифенокси)етан-1-ону, 5-метокси-2-метил-3-(3-(трифторметокси)бензил)аніліну, 3-(3-аміно-5-метокси-2-метилбензил)бензонітрилу, 5-метокси-2-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)аніліну, 3-аміно-5-бензил-4-метилбензонітрилу, 3-аміно-5-(3-ціанобензил)-4-метилбензонітрилу, 3-аміно-5-(4-фторбензил)-4-метилбензонітрилу, 3-аміно-5-(4-хлорбензил)-4-метилбензонітрилу, 3-аміно-4-метил-5-(3-нітробензил)бензонітрилу, 3-аміно-5-(3-бромбензил)-4-метилбензонітрилу та 3-аміно-4-метил-5-(2-(трифторметокси)бензил)бензонітрилу.

Існує велика кількість придатних відомих стандартних способів, таких як алкілування, галогенування, ацилування, амідування, оксидування, окиснення та відновлення. Вибір способів одержання, які є придатними, залежить від властивостей (реакційна здатність) замісників у проміжних сполуках. Такі реакції можна зручно здійснювати в розчиннику. Такі реакції можна зручно здійснювати за різних температур. Такі реакції можна зручно здійснювати в інертній атмосфері. Реагуючі речовини можна вводити в реакцію у присутності основи.

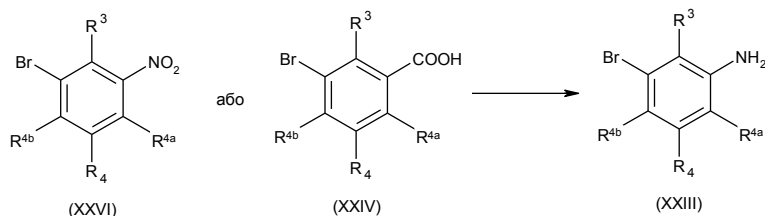
Реагуючі речовини можна вводити в реакцію одна з одною як такі, тобто без додавання розчинника або розріджувача. У більшості випадків, проте, переважним є додавання інертного розчинника або розріджувача або їх суміші. Якщо реакцію проводять у присутності основи, основи, які використовуються у надлишку, такі як триетиламін, піридин, N-метилморфолін або N,N-діетиламінін, також можуть діяти як розчинники або розріджувачі. Реакцію переважно проводять за температури, що знаходиться у діапазоні від приблизно -80 °C до приблизно +140 °C, переважно від приблизно -30 °C до приблизно +100 °C, у багатьох випадках у діапазоні від температури навколишнього середовища до приблизно +80 °C.

Сполуку формули (I) можна перетворювати способом, відомих per se, на іншу сполуку формули (I) шляхом заміни одного або більше замісників вихідної сполуки формули (I) стандартним способом іншим(-ми) замісником(-ами) за даним винаходом. Залежно від вибору умов реакції та вихідних матеріалів, які є придатними у кожному випадку, можливо, на одній стадії реакції замінювати тільки один замісник іншим замісником за даним винаходом, або можна замінювати декілька замісників іншими замісниками за даним винаходом на тій самій стадії реакції. Солі сполук формули (I) можна одержувати способом, відомих per se. Таким чином, наприклад, солі приєднання кислоти сполук формули (I) одержують шляхом обробки за допомогою придатної кислоти або придатного іонообмінного реагенту, та солі з основами одержують шляхом обробки за допомогою придатної основи або за допомогою придатного іонообмінного реагенту. Сіль вибирають залежно від її переносимості для застосування сполуки, такої як сільськогосподарська або фізіологічна переносимість. Солі сполук формули (I) можна перетворювати стандартним способом на вільні сполуки (I), солі приєднання кислоти, наприклад, шляхом обробки за допомогою придатної основної сполуки або за допомогою придатного іонообмінного реагенту, та солі з основами, наприклад, шляхом обробки за допомогою придатної кислоти або за допомогою придатного іонообмінного реагенту. Солі сполук формули (I) можна перетворювати способом, відомих per se, на інші солі сполук формули (I), солі приєднання кислоти, наприклад, на інші солі приєднання кислоти, наприклад, шляхом обробки солі неорганічної кислоти, такої як гідрохлорид, за допомогою придатної солі металу, такої як сіль натрію, барію або срібла, і кислоти, наприклад, за допомогою ацетату срібла, в придатному розчиннику, в якому неорганічна сіль, яка утворюється, наприклад хлорид срібла, є нерозчинною та, таким чином, осаджується з реакційної суміші.

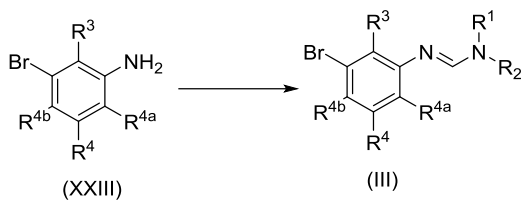
В одному варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб одержання сполук формули (I).

В іншому варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб одержання 3-заміщеної феніламідинової сполуки формули (I), де спосіб включає щонайменше одну з наступних стадій (a) – (h):

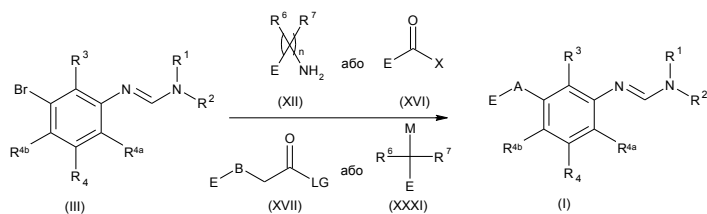
a) перетворення сполуки формули (XXVI) або (XXIV) на сполуку формули (XXIII) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



b) здійснення реакції сполуки формули (XXIII) з придатним вторинним аміном (HNR¹R²) з одержанням сполуки формули (III) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



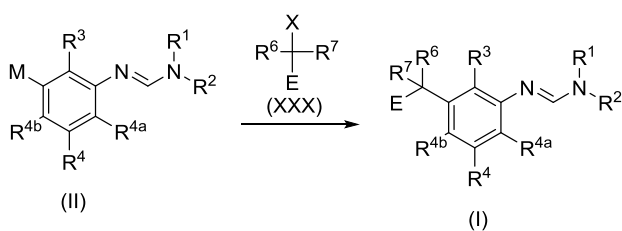
с) здійснення реакції сполуки формули (III) зі сполукою формули (XII), (XVI), (XVII) або (XXXI) з одержанням сполуки формули (I) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



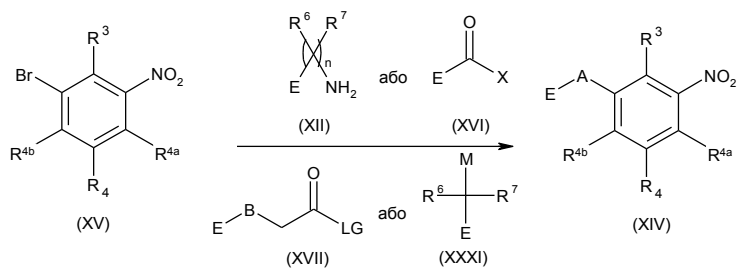
д) перетворення сполуки формули (III) на сполуку формули (II) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



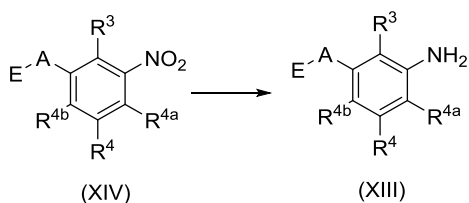
е) здійснення реакції сполуки формули (II) зі сполукою формули (XXX) з одержанням сполуки формули (I) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



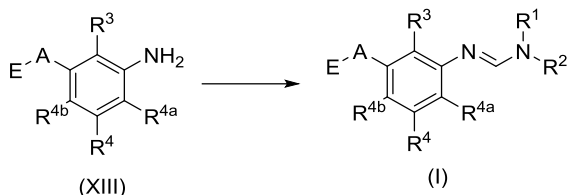
ф) здійснення реакції сполуки формули (XV) зі сполукою формули (XII), (XVI), (XVII) або (XXXI) з одержанням сполуки формули (XIV) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



г) перетворення сполуки формули (XIV) на сполуку формули (XIII) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



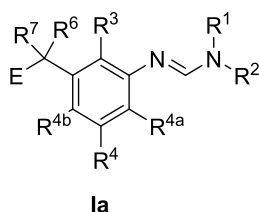
h) здійснення реакції сполуки формули (XIII) з придатним вторинним аміном (HNR^1R^2) з одержанням сполуки формули (I) відповідно до схеми реакції, зображеної нижче:



де на вказаних вище схемах, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{4a} , R^{4b} , A, X та E мають такі значення, як визначено вище, та M вибраний із групи, що складається з похідної літію, боронового естеру, боронової кислоти, MgX та ZnX .

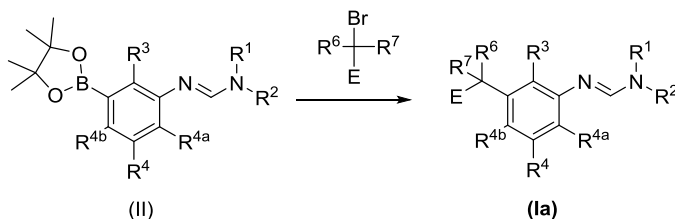
Сполуки за даним винаходом, визначені загальною формулою (I) та/або вказані в таблицях I, можна одержувати за допомогою відомих способів різноманітними шляхами, описаними на схемах 1–21.

A. Синтез C-місткової похідної амідину



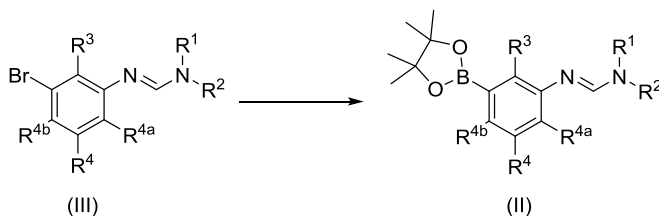
В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу ариламідин формули (Ia), де $\text{R}^1 - \text{R}^7$ є такими, як визначено в даному винаході, можна одержувати шляхом застосування способу, описаного на наступних схемах 1–8.

Схема 1



C-містковий амідин формули (Ia) можна одержувати шляхом перехресного сполучення, каталізованого паладієм, відповідних похідних боронатного естеру формули (II) з придатними арилгалогенідами у присутності основи, такої як карбонат калію або бікарбонат натрію, відповідно до аналогічної процедури, розкритої в рівні техніки, WO2018069841, як показано на схемі 1.

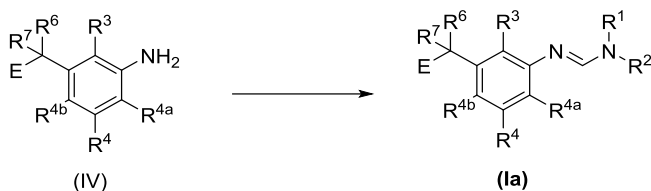
Схема 2



Боронатний естер похідної амідину формули (II) являє собою важливу проміжну сполуку, та його можна одержувати (схема 2) з відповідних галогенових похідних амідину формули (III) із застосуванням біспінаколатодиборану в присутності паладієвого каталізатора відповідно до способу борилування за Міяурою, розкритого в J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510.

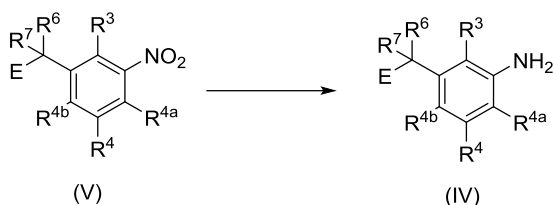
Ариламідин формули (Ia), де $\text{R}^1 - \text{R}^7$ визначені у даному документі вище, також можна одержувати поетапно шляхом застосування способу, описаного на наступних схемах 3–8.

Схема 3



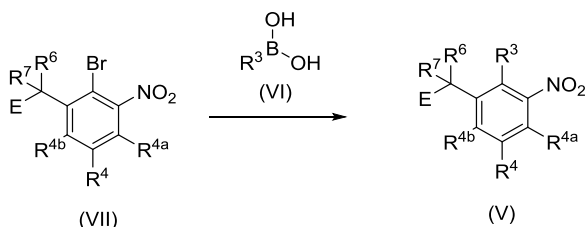
С-містковий амідин формули (Ia) можна одержувати шляхом обробки відповідних похідних аніліну формули (IV) за допомогою N-(диметоксиметил)-N-метилетанаміну в 1,4-діоксані із застосуванням каталітичної кількості безводної p-толуолсульфонової кислоти відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US20110130282.

Схема 4



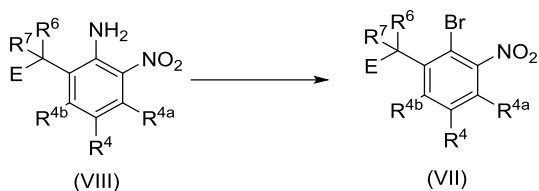
Похідну аніліну формули (IV) можна одержувати шляхом відновлення відповідної проміжної нітросполуки формули (V) шляхом застосування різноманітних способів відновлення, розкритих у літературних джерелах, наприклад за допомогою порошку заліза у присутності водного хлориду амонію або гідрогенізації у присутності Pd/C, відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US2006194801A1.

Схема 5



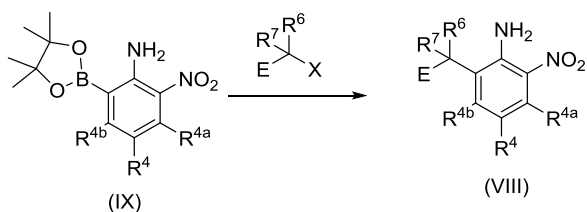
Сполуку формули (V), де R³ переважно являє собою алکیلні групи, можна одержувати шляхом перехресного сполучення, каталізованого паладієм, відповідної алкілборонової кислоти формули (VI) з похідною бром формули (VII) у присутності основи, наприклад карбонату калію або фосфату калію, відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US2017355679A1.

Схема 6



Відповідні галогенові похідні формули (VII) можна одержувати шляхом здійснення реакції Зандмейєра відповідних похідних аніліну формули (VIII) відповідно до аналогічної процедури, розкритої в J. Org. Chem., 1980, 45, 2570-2575. Даний підхід забезпечує різні можливості функціоналізації за даного положення шляхом перетворення відповідної аміногрупи на різні атоми галогену, нітрилу, гідрокси, трифторметилу тощо, як розкрито у J. Fluorine Chem., 2001, 107, 31-34 та Synthesis, 2007, 81-84.

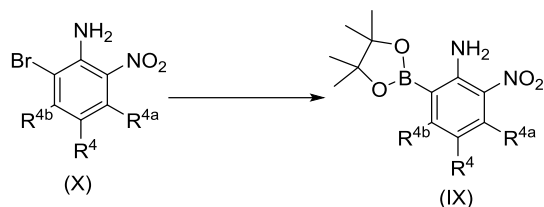
Схема 7



С-місткову похідну формули (VIII) можна одержувати з проміжної сполуки боронатного естеру формули (IX) відповідно до реакції сполучення за Сузукі з різноманітними бензил-, гетероарил- або алкілбромідами у

присутності паладієвого каталізатора відповідно до аналогічної процедури, розкритої у WO2018069841.

Схема 8



Похідну боронатного естеру формули (IX) можна одержувати з відповідної комерційно доступної похідної бромової формули (X) із застосуванням біспінаколатодиборану в присутності паладієвого каталізатора відповідно до реакції борилування за Міяурою із застосуванням придатної основи, як розкрито в WO 2016210234.

В. Синтез N-місткової похідної амідину формули (Ib та Ic)

В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу ариламідин формули (Ib), де $R^1 - R^7$ визначені у даному документі вище, можна одержувати шляхом застосування способу, описаного на наступних схемах 9–10.

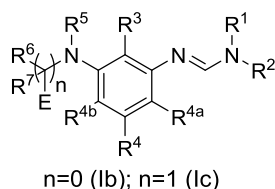
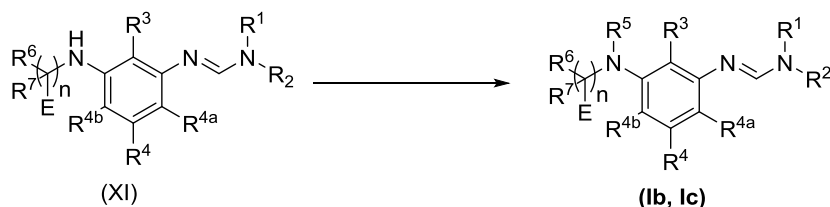
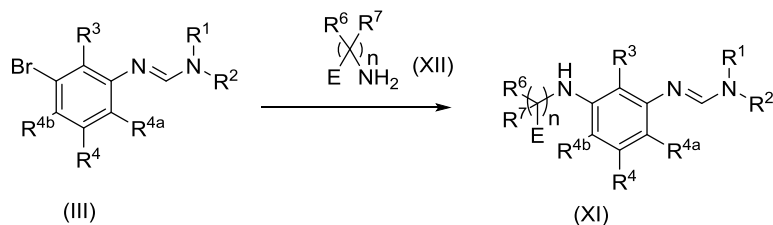


Схема 9



N-містковий амідин формули (Ib) можна одержувати шляхом N-алкілювання похідної амідину формули (XI) у присутності придатної основи та придатного алкілгалогеніду, де R^5 визначений у даному документі вище, відповідно до аналогічної процедури, розкритої в WO2018069842.

Схема 10



Похідну амідину формули (XI) одержують шляхом перехресного сполучення, каталізованого паладієм, відповідних похідних аміну формули (XII) у присутності придатної основи відповідно до реакції сполучення Бухвальда-Гартвіга, як розкрито в J. Med. Chem, 2012, 55,19, 8538-48 та J. Org. Chem., 2010, 75, 19, 6477-88.

С. Синтез O- та S-місткової похідної амідину формули (Id та Ie)

В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу ариламідин формули (Id та Ie), де $R^1 - R^7$ визначені у даному документі вище, можна одержувати шляхом застосування способу, описаного на наступних схемах 11–13.

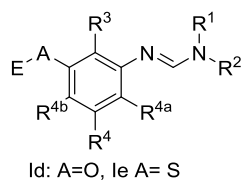
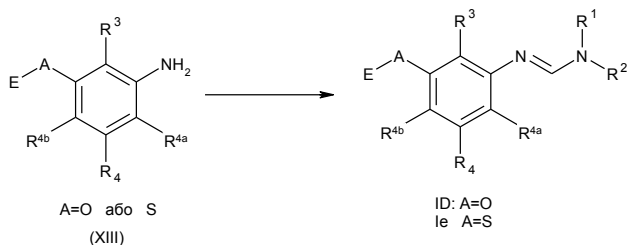
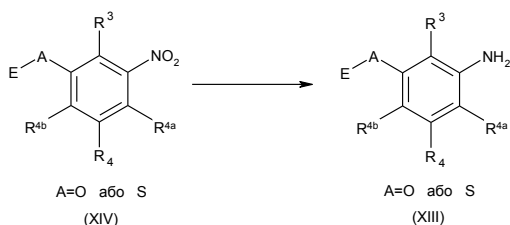


Схема 11



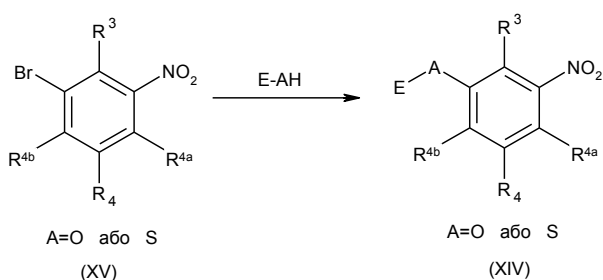
В одному варіанті здійснення сполуку формули (Id та Ie) можна одержувати шляхом обробки відповідних похідних аніліну формули (XIII) за допомогою надлишку триметилортоформіату із застосуванням каталітичної кількості п-толуолсульфонової кислоти (схема 11). Одержану проміжну сполуку нагрівали з вторинним аміном (HNR^1R^2) у діоксані з одержанням необхідних похідних амідину відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US20110130282.

Схема 12



Похідна аміну формули (XIII) являє собою ключову проміжну сполуку, одержану шляхом відновлення проміжної нітросполуки формули (XIV) із застосуванням заліза та водн. хлориду амонію або хлориду олова(II) в хлористоводневій кислоті в придатному розчиннику та за придатної температури відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US2006194801A1.

Схема 13

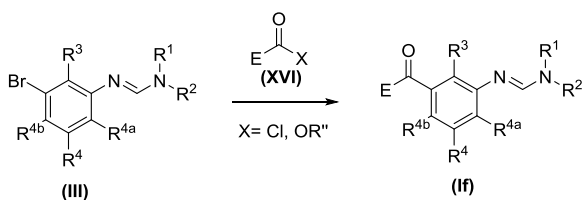


Нітропохідна формули (XIV) являє собою важливу проміжну сполуку, та її можна одержувати шляхом здійснення реакції сполучення галогенової похідної формули (XV) та відповідних заміщених фенолів або тіофенолів із застосуванням придатного реагенту на основі міді(I) та розчинника відповідно до аналогічної процедури, розкритої у WO2018069842.

D. Синтез карбоніл-місткової похідної амідину типу (If)

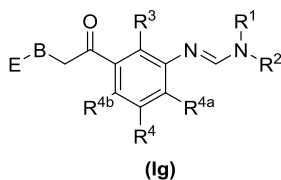
В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу похідну формамідину формули (If) можна одержувати шляхом застосування способу, описаного на наступній схемі 14.

Схема 14



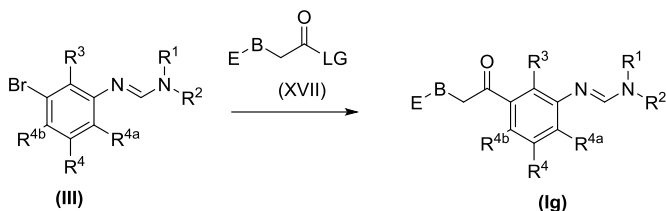
Похідну амідину формули (If) одержують шляхом здійснення реакції ацилювання із застосуванням обміну металу і галогену сполук формули (III) у присутності придатних літійованих реагентів/реагентів Грільєра із наступною обробкою за допомогою відповідного естеру або похідних аміду Вайнреба формули (XVI) та відповідно до аналогічного способу, розкритого в Angew.Chem. Int. Ed., 56(43), 13319-13323 та J. Org. Chem., 67(11), 3585-3594; 2002.

E. Синтез карбонілметил-місткової похідної амідину формули (Ig)



В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу похідну амідину формули (Ig), де $R^1 - R^7$ визначені у даному документі вище, де В являє собою О, S, N, можна одержувати за допомогою способу, описаного на наступній схемі 15.

Схема 15



Похідну амідину формули (Ig) одержують шляхом застосування обміну металу і галогену сполук формули (III) у присутності придатних літійованих реагентів/реагентів Грін'єра із наступною обробкою за допомогою відповідного естеру або похідних амідів Вайнреба формули (XVII) та відповідно до аналогічного способу, розкритого в Chem. Pharma. Bull., 2001, 49(2), 173-182, WO 2012029942 та Eur. J. Med. Chem., 2013, 69, 244 – 261.

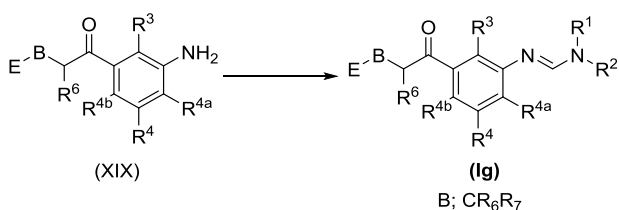
Схема 16



Ключову проміжну сполуку формули (XVI) одержують шляхом здійснення реакції алкілювання із застосуванням етилбромацетату з відповідними фенолами, тіофенолами та анілінами у присутності придатної основи відповідно до аналогічної процедури, розкритої в Tet. Lett., 2012, 53, 15, 2001–2004 та J. Med. Chem., 2012, 55, 1, 515 – 527.

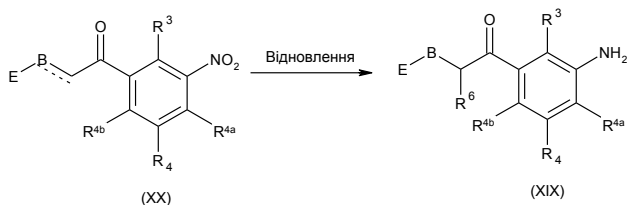
В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу ариламідину формули (Ig), де $R^1 - R^7$ визначені у даному документі вище, та В являє собою CR^6R^7 , можна одержувати за допомогою способу, описаного на наступних схемах 17–20.

Схема 17



Сполуку формули (Ig) можна одержувати шляхом обробки відповідних похідних аніліну формули (XIX) за допомогою надлишку триметилортоформіату із застосуванням каталітичної кількості п-толуолсульфонові кислоти (схема 17). Одержану проміжну сполуку нагрівали з вторинним аміном (HNR^1R^2) в діоксані з одержанням сполуки формули (Ig) відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US20110130282.

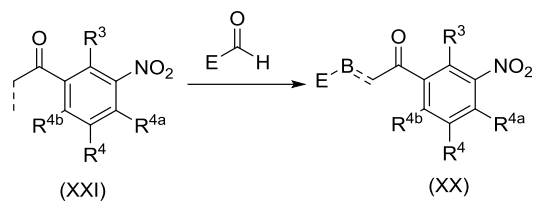
Схема 18



Похідна аміну формули (XIX) являє собою ключову проміжну сполуку, одержану шляхом відновлення проміжної нітросполуки формули (XX) із застосуванням заліза та водн. хлориду амонію або хлориду олова(II) в хлористоводневій кислоті в придатному розчиннику та за придатної температури відповідно до аналогічної

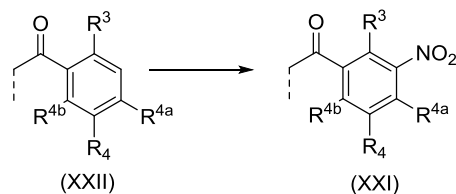
процедури, розкритої в US2006194801A1.

Схема 19



Проміжну нітросполуку формули (XX) можна одержувати шляхом здійснення альдольної конденсації проміжної сполуки кетону формули (XXI) з відповідними похідними альдегіду/кетону в присутності придатної основи, наприклад водного гідроксиду натрію або калію, відповідно до аналогічної процедури, розкритої в Synthesis, 1980, 8, 647-650.

Схема 20

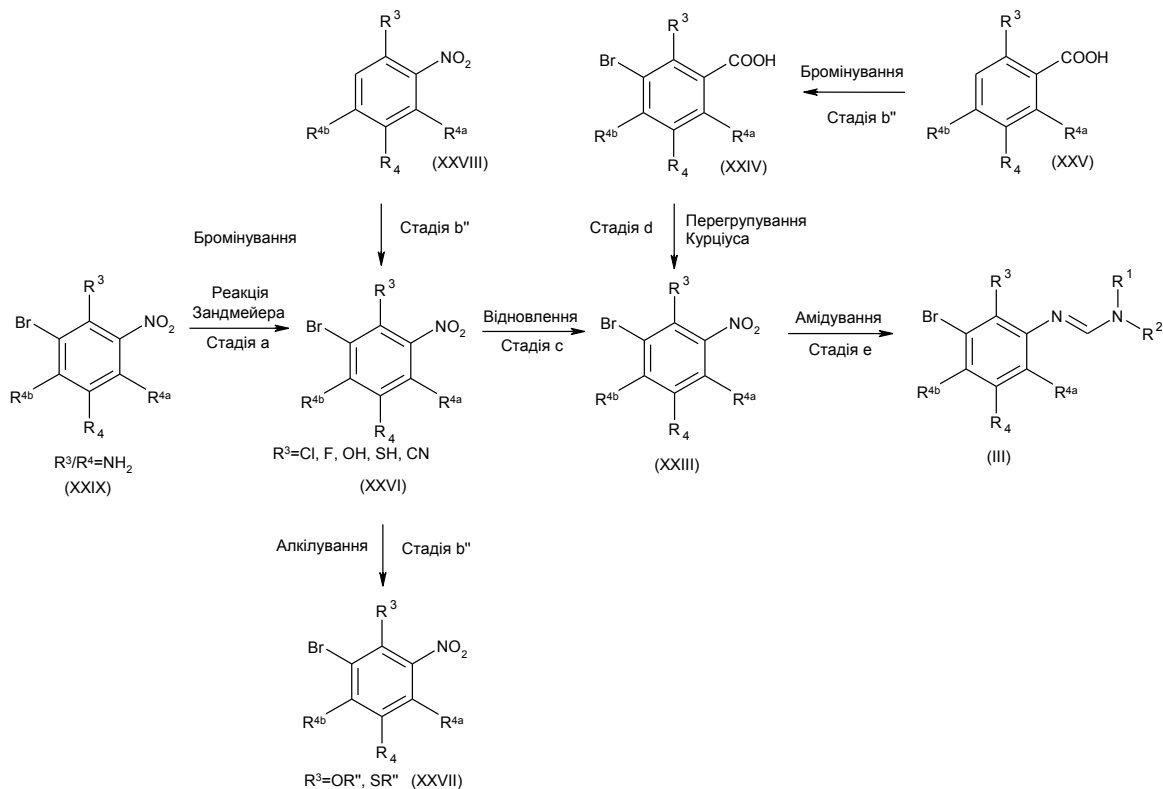


Проміжну нітросполуку формули (XXI) можна одержувати шляхом нітрування відповідного комерційно доступного ацетофенону відповідно до аналогічної процедури, розкритої в J.Org. Chem., 1986, 51, 3439 – 3446.

F. Синтез похідної 3-бромамідину формули (III)

В одному варіанті здійснення відповідно до даного винаходу важливу ключову проміжну сполуку ариламідину формули (III), де $R^1 - R^4$ визначені у даному документі вище, можна одержувати шляхом застосування способу, описаного на наступній схемі 21.

Схема 21



Сполуку формули (III) можна одержувати шляхом обробки відповідних похідних аніліну формули (XXIII) за допомогою надлишку триметилортоформиату із застосуванням каталітичної кількості п-толуолсульфонової кислоти (схема 21, стадія е). Одержану проміжну сполуку нагрівали з вторинним аміном (HNR^1R^2) в діоксані з одержанням сполуки формули (III) відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US20110130282.

Проміжну сполуку аніліну формули (XXIII) можна одержувати за допомогою одного зі способів, описаних на

схемі 21.

В одному варіанті здійснення проміжну сполуку аніліну формули (XXIII) одержують із відповідної заміщеної 3-бромбензойної кислоти формули (XXIV) шляхом здійснення перегрупування Курціуса (схема 21, стадія d) у присутності дифенілфосфорилазиду із наступною обробкою кислотою відповідно до аналогічної процедури, розкритої в J. Am. Chem. Soc., 2005, 127, 16408 та Org. Lett., 2012, 14, 608-611. Проміжну сполуку 3-бромбензойної кислоти формули (XXIV) можна одержувати шляхом бромовання (схема 21, стадія b'') комерційно доступної 2,5-дизаміщеної бензойної кислоти (XXV) відповідно до способу, розкритого в літературних джерелах, розкритого в J. Org. Chem., 2013, 78, 2589-2599.

Проміжні сполуки аніліну формули (XXIII) альтернативно (схема 21, стадія c) одержують із проміжної нітросполуки формули (XXVI) шляхом відновлення відповідної нітрофункціональної групи формули (XXVI) у присутності придатного відновника, наприклад заліза та водн. хлориду амонію або хлориду олова(II) в хлористоводневій кислоті, у придатному розчиннику відповідно до аналогічної процедури, розкритої в US2006194801 A1 та J. Am. Chem. Soc., 2003, 125, 40, 12074-12075.

Проміжну нітросполуку формули (XXVI) альтернативно можна одержувати з комерційно доступної проміжної сполуки нітроаніліну формули (XXIX) шляхом здійснення реакції Зандмейєра (схема 21, стадія a) із наступним радикал-нуклеофілним заміщенням, як розкрито в літературних джерелах JOC, 1980, 45, 2570-2575; Synlett, 2012, 23, 13, 1893 – 1896 та Org Pro Res and Dev, 2003, 7, 5, p. 762 – 768.

Проміжну нітросполуку формули (XXVI), де група R³/R⁴ переважно являє собою OH, SH, можна алкілувати за допомогою придатного алкілувального засобу (схема 21, стадія b'') для одержання проміжних нітросполук формули (XXVII) із придатною групою R".

Проміжну нітросполуку формули (XXVI) альтернативно можна одержувати з комерційно доступної проміжної сполуки нітробензолу формули (XXVIII) шляхом здійснення реакції бромовання (схема 21, стадія b'') для одержання 3-бром-2,5-дизаміщеної похідної нітробензолу, як розкрито в способі, розкритому в літературних джерелах Chem Comm. 2012, 48, 3442-3444; Bio. Org. Med. Chem 2014, 22, 1156-1162.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлене застосування сполук формули (I) та композицій на їхній основі для контролю та/або попередження фітопатогенних грибів сільськогосподарських культур та/або садових культур.

В іншому варіанті здійснення у даному винаході представлене застосування сполук формули (I) та композицій на їхній основі для контролю іржавих хвороб сільськогосподарських культур та/або садових культур.

У переважному варіанті здійснення у даному винаході представлене застосування сполуки формули (I) та композицій на її основі, які, зокрема, є придатними для контролю та/або попередження хвороб сільськогосподарських культур, таких як злакові культури, кукурудза, соя та інші бобові рослини; плоди та плодіві дерева; горіхи та горіхові дерева; цитрусові та цитрусові дерева; будь-які садові рослини; олійні рослини; кавове дерево, чайна рослина та інші овочі та декоративні рослини.

У більш переважному варіанті здійснення сполуки формули (I) можна застосовувати для обробки декількох грибкових патогенів. Необмежувальні приклади патогенів, які зумовлюють розвиток грибкових хвороб, що можуть бути виликувані згідно з даним винаходом, включають:

хвороби, спричинені патогенами, що зумовлюють розвиток борошнистої роси, наприклад видами роду *Blumeria*, наприклад *Blumeria graminis*; видами роду *Podosphaera*, наприклад *Podosphaera leucotricha*; видами роду *Sphaerotheca*, наприклад *Sphaerotheca fuliginea*; видами роду *Uncinula*, наприклад *Uncinula necator*; видами роду *Erysiphe*, наприклад *Erysiphe cichoracearum*;

хвороби, спричинені патогенами іржавих хвороб, наприклад видами роду *Gymnosporangium*, наприклад *Gymnosporangium sabinae*; видами роду *Hemileia*, наприклад *Hemileia vastatrix*; видами роду *Phakopsora*, наприклад *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomia*; видами роду *Puccinia*, наприклад *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* або *Puccinia striiformis* та *Puccinia melanocephala*; видами роду *Uromyces*, наприклад *Uromyces appendiculatus*;

зокрема, *Cronartium ribicola* (пухирчаста іржа); *Gymnosporangium juniperi-virginiana* (іржа яблуні і кедра); *Hemileia vastatrix* (кавова іржа); *Phakopsora meibomia* та *P. pachyrhizi* (іржа сої); *Puccinia coronata* (корончата іржа вівса та райграсу); *Puccinia graminis* (стеблова іржа пшениці та тонконогу лучного або чорна іржа злакових культур); *Puccinia hemerocallidis* (іржа лілійника); *Puccinia persistens* subsp. *triticea* (іржа пшениці або 'бура або червона іржа'); *Puccinia sorghi* (іржа кукурудзи); *Puccinia striiformis* ('жовта іржа' злакових культур); *Puccinia melanocephala*; *Uromyces appendiculatus* (іржа бобових); *Uromyces phaseoli* (іржа бобових); *Puccinia melanocephala* ('бура іржа' цукрової тростини); *Puccinia kuehnii* ('помаранчева іржа' цукрової тростини);

хвороби, спричинені патогенами з групи ооміцетів, наприклад видами роду *Albugo*, наприклад *Albugo candida*; видами роду *Bremia*, наприклад *Bremia lactucae*; видами роду *Peronospora*, наприклад *Peronospora pisi* або *P. brassicae*; видами роду *Phytophthora*, наприклад *Phytophthora infestans*; видами роду *Plasmopara*, наприклад *Plasmopara viticola*; видами роду *Pseudoperonospora*, наприклад *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*; видами роду *Pythium*, наприклад *Pythium ultimum*;

хвороби плямистості листя і хвороби в'янення листя, спричинені, наприклад, видами роду *Alternaria*, наприклад *Alternaria solani*; видами роду *Cercospora*, наприклад *Cercospora beticola*; видами роду *Cladosporium*, наприклад *Cladosporium cucumerinum*; видами роду *Cochliobolus*, наприклад *Cochliobolus sativus* (конідіальна форма: під *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*) або *Cochliobolus miyabeanus*; видами роду *Colletotrichum*, наприклад *Colletotrichum lindemuthianum*, *Colletotrichum capsici*; видами роду *Cycloconium*, наприклад *Cycloconium oleaginum*; видами роду *Diaporthe*, наприклад *Diaporthe citri*; видами роду *Elsinoe*, наприклад *Elsinoe fawcettii*; видами роду *Gloeosporium*, наприклад *Gloeosporium laeticolor*; видами роду *Glomerella*, наприклад *Glomerella cingulata*; видами роду *Guignardia*, наприклад *Guignardia bidwelli*; видами роду *Leptosphaeria*, наприклад *Leptosphaeria maculans*; видами роду *Magnaporthe*, наприклад *Magnaporthe grisea*; видами роду *Microdochium*, наприклад *Microdochium nivale*; видами роду *Mycosphaerella*, наприклад *Mycosphaerella graminicola*,

Mycosphaerella arachidicola або *Mycosphaerella fijiensis*; видами роду *Phaeosphaeria*, наприклад *Phaeosphaeria nodorum*; видами роду *Pyrenophora*, наприклад *Pyrenophora teres* або *Pyrenophora tritici repentis*; видами роду *Ramularia*, наприклад *Ramularia collo-cygni* або *Ramularia areola*; видами роду *Rhynchosporium*, наприклад *Rhynchosporium secalis*; видами роду *Septoria*, наприклад *Septoria apii*, *Septoria tritici* або *Septoria lycopersici*; видами роду *Stagonospora*, наприклад *Stagonospora nodorum*; видами роду *Typhula*, наприклад *Typhula incarnata*; видами роду *Venturia*, наприклад *Venturia inaequalis*;

хвороби кореня і стебла, спричинені, наприклад, видами роду *Corticium*, наприклад *Corticium graminearum*; видами роду *Fusarium*, наприклад *Fusarium oxysporum*; видами роду *Gaeumannomyces*, наприклад *Gaeumannomyces graminis*; видами роду *Plasmodiophora*, наприклад *Plasmodiophora brassicae*; видами роду *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*; видами роду *Sarocladium*, наприклад *Sarocladium oryzae*; видами роду *Sclerotium*, наприклад *Sclerotium oryzae*; видами роду *Tapesia*, наприклад *Tapesia acuformis*; видами роду *Thielaviopsis*, наприклад *Thielaviopsis basicola*; видами роду *Ganoderma*, наприклад *Ganoderma lucidum*;

хвороби колосу та волоті (включаючи качани кукурудзи), спричинені, наприклад, видами роду *Alternaria*, наприклад *Alternaria spp.*; видами роду *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus flavus*; видами роду *Cladosporium*, наприклад *Cladosporium cladosporioides*; видами роду *Claviceps*, наприклад *Claviceps purpurea*; видами роду *Fusarium*, наприклад *Fusarium culmorum*; видами роду *Gibberella*, наприклад *Gibberella zeae*; видами роду *Monographella*, наприклад *Monographella nivalis*; видами роду *Stagonospora*, наприклад *Stagonospora nodorum*;

хвороби, спричинені сажковими грибами, наприклад видами роду *Sphacelotheca*, наприклад *Sphacelotheca reiliana*; видами роду *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries* або *Tilletia controversa*; видами роду *Urocystis*, наприклад *Urocystis occulta*; видами роду *Ustilago*, наприклад *Ustilago nuda*;

плодова гниль, спричинена, наприклад, видами роду *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus flavus*; видами роду *Botrytis*, наприклад *Botrytis cinerea*; видами роду *Penicillium*, наприклад *Penicillium expansum* або *Penicillium purpurogenum*; видами роду *Rhizopus*, наприклад *Rhizopus stolonifer*; видами роду *Sclerotinia*, наприклад *Sclerotinia sclerotiorum*; видами роду *Verticillium*, наприклад *Verticillium albo-atrum*;

гниль та хвороби в'янення листя, що передаються через насіння або ґрунт, а також хвороби сходів, спричинені, наприклад, видами роду *Alternaria*, наприклад *Alternaria brassicicola*; видами роду *Aphanomyces*, наприклад *Aphanomyces euteiches*; видами роду *Ascochyta*, наприклад *Ascochyta lentis*; видами роду *Aspergillus*, наприклад *Aspergillus flavus*; видами роду *Cladosporium*, наприклад *Cladosporium herbarum*; видами роду *Cochliobolus*, наприклад *Cochliobolus sativus* (конідиальна форма: під *Drechslera*, під *Bipolaris*, син.: *Helminthosporium*); видами роду *Colletotrichum*, наприклад *Colletotrichum coccodes*; видами роду *Fusarium*, наприклад *Fusarium culmorum*; видами роду *Gibberella*, наприклад *Gibberella zeae*; видами роду *Macrophomina*, наприклад *Macrophomina phaseolina*; видами роду *Microdochium*, наприклад *Microdochium nivale*; видами роду *Monographella*, наприклад *Monographella nivalis*; видами роду *Penicillium*, наприклад *Penicillium expansum*; видами роду *Phoma*, наприклад *Phoma lingam*; видами роду *Phomopsis*, наприклад *Phomopsis sojae*; видами роду *Phytophthora*, наприклад *Phytophthora cactorum*; видами роду *Pyrenophora*, наприклад *Pyrenophora graminea*; видами роду *Pyricularia*, наприклад *Pyricularia oryzae*; видами роду *Pythium*, наприклад *Pythium ultimum*; видами роду *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*; видами роду *Rhizopus*, наприклад *Rhizopus oryzae*; видами роду *Sclerotium*, наприклад *Sclerotium rolfsii*; видами роду *Septoria*, наприклад *Septoria nodorum*; видами роду *Typhula*, наприклад *Typhula incarnata*; видами роду *Verticillium*, наприклад *Verticillium dahliae*;

виразки, гали і відьмина мітла, спричинені, наприклад, видами роду *Nectria*, наприклад *Nectria galligena*;

хвороби в'янення, спричинені, наприклад, видами роду *Monilinia*, наприклад *Monilinia laxa*;

деформації листя, квіток і плодів, спричинені, наприклад, видами роду *Exobasidium*, наприклад *Exobasidium vexans*; видами роду *Taphrina*, наприклад *Taphrina deformans*;

дегенеративні хвороби деревних рослин, спричинені, наприклад, видами роду *Esca*, наприклад *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* або *Fomitiporia mediterranea*; видами роду *Ganoderma*, наприклад *Ganoderma boninense*;

хвороби квітів і насіння, спричинені, наприклад, видами роду *Botrytis*, наприклад *Botrytis cinerea*;

хвороби бульб рослин, спричинені, наприклад, видами роду *Rhizoctonia*, наприклад *Rhizoctonia solani*; видами роду *Helminthosporium*, наприклад *Helminthosporium solani*;

хвороби, спричинені бактеріальними патогенами, наприклад видами роду *Xanthomonas*, наприклад *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами роду *Pseudomonas*, наприклад *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами роду *Erwinia*, наприклад *Erwinia amylovora*; видами роду *Ralstonia*, наприклад *Ralstonia solanacearum*;

грибкові хвороби на коренях і основі стебла, спричинені, наприклад, чорною кореневою гниллю (*Calonectria crotalariae*), вугільною гниллю (*Macrophomina phaseolina*), фузаріозною гниллю або в'яненням, кореневою гниллю і гниллю стручків і гілок (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), кореневою гниллю, спричиненою видами роду *Mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*), *Neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfecta*), гниллю бобів і стебел (*Diaporthe phaseolorum*), раком стебла (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фітофторозною гниллю (*Phytophthora megasperma*), бурою гниллю стебла (*Phialophora gregata*), грибною гниллю (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), ризоктоніозною кореневою гниллю, гниттям стебла і чорною ніжкою (*Rhizoctonia solani*), склеротіозним гниттям стебла (*Sclerotinia sclerotiorum*), склеротіозною південною гниллю (*Sclerotinia rolfsii*), кореневою гниллю, спричиненою видом роду *Thielaviopsis* (*Thielaviopsis basicola*).

Рослини, які можуть бути оброблені відповідно до даного винаходу, включають наступні: *Rosaceae* sp. (наприклад, фруктові дерева з плодом-яблуком, такі як види яблука, груші, абрикоси, вишні, мигдалю і персика), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (наприклад, види банана і їхні плантації), *Rubiaceae* sp. (наприклад, кава), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (наприклад, види лимона, апельсина і грейпфрута); *Vitaceae* sp. (наприклад, види винограду); *Solanaceae* sp. (наприклад, види томатів, перцю), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp.

(наприклад, салат-латук), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp. (наприклад, огірок), Alliaceae sp. (наприклад, цибуля пора, цибуля), Papilionaceae sp. (наприклад, види гороху); основні культурні рослини, такі як Poaceae/Gramineae sp. (наприклад, кукурудза, дерен, злакові культури, такі як пшениця, жито, рис, ячмінь, овес, просо і тритикале), Asteraceae sp. (наприклад, соняшник), Brassicaceae sp. (наприклад, капуста білоголова, капуста червоноголова, броколі, цвітна капуста, брюссельська капуста, пекінська капуста, кольрабі, види редису та олійний рапс, гірчиця, хрін і крес-салат), Fabaceae sp. (наприклад, боби, види арахісу), Papilionaceae sp. (наприклад, соя), Solanaceae sp. (наприклад, види картоплі), Chenopodiaceae sp. (наприклад, цукровий буряк, кормовий буряк, листовий буряк, червоний буряк); Malvaceae (наприклад, бавовник); корисні рослини і декоративні рослини для садів і лісної місцевості і генетично модифіковані різновиди кожного з цих видів рослин.

Більшу перевагу надають здійсненню контролю наступних хвороб сої. Грибкові хвороби на листках, стеблах, стручках та насінні, спричинені, наприклад, плямистістю листків від *Alternaria* (*Alternaria* spec. *atrans tenuissima*), антракнозом (*Colletotrichum gloeosporioides dematium* var. *truncatum*), бурою плямистістю (*Septoria glycines*), плямистістю листків та в'яненням від *Cercospora* (*Cercospora kikuchii*), в'яненням листків від *Choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), плямистістю листків від *Dactulophora* (*Dactulophora glycines*), несправжньою борошнистою росою (*Peronospora manshurica*), в'яненням від *Drechslera* (*Drechslera glycini*), селеноморфозною плямистістю листків (*Cercospora sojae*), плямистістю листків від *Leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), плямистістю листків від *Phyllosticta* (*Phyllosticta sojaecola*), в'яненням стручків та стебел (*Phomopsis sojae*), борошнистою росою (*Microsphaera diffusa*), плямистістю листків від *Pyrenochaeta* (*Pyrenochaeta glycines*), в'яненням надземної частини, листя та диску від *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), іржею (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), паршею (*Sphaceloma glycines*), в'яненням листя від *Stemphylium* (*Stemphylium botryosum*), мішенеподібною плямистістю (*Corynespora cassicola*).

Даний винахід також стосується застосування сполук формули I, комбінацій або композицій на їхній основі для контролю або попередження наступних хвороб рослин: *Puccinia* spp. (види іржі) на різноманітних рослинах, наприклад без обмеження *P. tritici* (бура або листова іржа), *P. striiformis* (лінійна або жовта іржа), *Puccinia melanoscephala* (іржа цукрової тростини), *P. hordei* (іржа низькорослих рослин), *P. graminis* (стеблова або чорна іржа) або *P. recondita* (бура або листова іржа) на злакових культурах, таких як, наприклад, пшениця, ячмінь або жито, та *Phakopsora* spp. на різноманітних рослинах, зокрема *Phakopsora pachyrhizi* та *P. meibomiae* (іржа сої) на соєвих бобах, *Hemileia vastatrix* (кавова іржа), *Uromyces appendiculatus*, *Uromyces fabae* та *Uromyces phaseoli* (іржа бобових).

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлено застосування сполук формули (I) та композицій на їхній основі для контролю та/або попередження хвороб рослин, спричинених патогенами, такими як *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Botrytis cinerea*, *Alternaria solani*, *Colletotrichum capsici*, *Septoria lycopersici*, *Fusarium culmorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Puccinia tritici*, *Septoria tritici*, *Phytophthora infestans*, *Plasmopara viticola* або *Uncinula necator*.

У переважному варіанті здійснення у даному винаході представлено застосування сполук формули (I) та композицій на їхній основі для контролю та/або попередження хвороб рослин, таких як *Puccinia* spp. (види іржі) на різноманітних рослинах, без обмеження вибрані з *P. tritici* (бура або листова іржа), *P. striiformis* (лінійна або жовта іржа), *P. hordei* (іржа низькорослих рослин), *P. graminis* (стеблова або чорна іржа) або *P. recondita* (бура або листова іржа) на злакових культурах, вибраних із пшениці, ячменю або жита, та *Phakopsora* spp. на різноманітних рослинах, зокрема *Phakopsora pachyrhizi* та *P. meibomiae* (іржа сої) на соєвих бобах.

У більш переважному варіанті здійснення у даному винаході представлено застосування сполуки формул (I) та композицій на їхній основі для контролю та/або попередження появи фітопатогенних грибів, таких як *Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*, сільськогосподарських культур та/або садових культур.

У даному винаході представлений спосіб контролю небажаних мікроорганізмів, де сполуки формули (I) застосовують щодо мікроорганізмів та/або їхнього середовища перебування.

Даний винахід додатково передбачає спосіб захисту насінини від небажаних мікроорганізмів шляхом застосування насінини, обробленої щонайменше однією сполукою формули (I).

Сполуки формули (I) можуть проявляти сильну активність щодо мікроорганізмів та можуть застосовуватися для контролю небажаних мікроорганізмів, таких як гриби та бактерії, для захисту сільськогосподарських культур та для захисту таких матеріалів.

Сполуки формули (I) проявляють фунгіцидні властивості та можуть застосовуватися для захисту сільськогосподарських культур, наприклад для контролю *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* та *Deuteromycetes*.

Сполуки формули (I) можна застосовувати як бактерициди для захисту сільськогосподарських культур, наприклад для контролю *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* і *Streptomycetaceae*.

Сполуки формули (I) можна застосовувати для контролю фітопатогенних грибів, здійснюваного з лікувальною або захисною метою. Отже, даний винахід також стосується способів лікування та захисту для контролю фітопатогенних грибів шляхом застосування активних інгредієнтів або композицій, які застосовують щодо насінини, рослини або частин рослини, плодів або ґрунту, в якому ростуть рослини.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлена композиція для контролю та/або попередження фітопатогенних мікроорганізмів, що містить сполуку формули (I), її ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи, N-оксиди, S-оксиди або прийнятні з погляду сільського господарства солі та один або більше інертних носіїв.

У даному винаході представлена композиція, де концентрація сполуки формули (I) знаходиться в діапазоні від 10 до 90 % за вагою відносно загальної ваги композиції, переважно від 30 до 70 % за вагою відносно загальної ваги композиції.

Композиція може додатково містити одну або більше активних сумісних сполук, вибраних із фунгіцидів, інсектицидів, нематодцидів, акарицидів, біопестицидів, гербіцидів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, поживних речовин або добрив.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлена комбінація, що містить сполуку формули (I), її ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи, N-оксиди, S-оксиди або прийнятні з погляду сільського господарства солі та одну або більше активних сумісних сполук, вибраних із фунгіцидів, інсектицидів, нематодцидів, акарицидів, біопестицидів, гербіцидів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, поживних речовин або добрив.

Згідно з даним винаходом, як визначено вище, носій являє собою природну або синтетичну, органічну або неорганічну речовину, з якою змішують або об'єднують активні інгредієнти для кращої застосовності, зокрема для застосування щодо рослин, або частин рослин, або насінини. Носій, який може бути твердим або рідким, загалом є інертним та повинен бути придатним для застосування в галузі сільського господарства.

Застосовні тверді носії включають, наприклад, амонієві солі і порошки природних порід, таких як каоліни, глини, тальк, вапняк, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомітова земля, і порошки штучних порід, таких як дрібнодисперсний діоксид кремнію, оксиди алюмінію й силікати; застосовні тверді носії для одержання гранул включають, наприклад, подрібнені та фракціоновані природні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт і доломіт, а також штучні гранули з порошків неорганічних і органічних матеріалів і гранули з органічного матеріалу, такого як папір, деревна тирса, шкаралупа кокосового горіха, початки кукурудзи і стебла тютюну; застосовні емульгатори та/або піноутворювачі включають, наприклад, неіонні та аніонні емульгатори, такі як естери поліоксиетилену та жирних кислот, естери поліоксиетилену та жирних спиртів, наприклад етери алкіларилу та полігліколю, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білків; придатними диспергувальними речовинами є неіонні та/або іонні речовини, наприклад, із наступних класів: POE-спирти та/або POP-етери, естери POE і кислоти та/або POP, етери POE і алкіларилу та/або POP, аддукти POE і жирів та/або POP, похідні POE- та/або POP-поліолу, аддукти POE- та/або POP-сорбітану або -цукру, алкіл- або арилсульфати, алкіл- або арилсульфонати і алкіл- або арилфосфати або відповідні аддукти PO-етеру. Додатково придатними є оліго- або полімери, наприклад одержані з вінілових мономерів, з акрилової кислоти, з EO та/або PO окремо або в комбінації з, наприклад, (полі)спиртами або (полі)амінами. Також можна застосовувати лігнін і його похідні сульфокислот, немодифіковані й модифіковані види целюлози, ароматичні та/або аліфатичні сульфокислоти, а також їхні аддукти з формальдегідом.

Активні інгредієнти можуть застосовуватися як такі, або можуть бути перетворені на звичайні склади, або можуть знаходитися у формі їхніх складів, або можуть знаходитися у формах для використання, одержаних із них, таких як готові до використання розчини, емульсії, суспензії на водній або масляній основі, порошки, змочувані порошки, пасти, розчинні порошки, розчинні таблетки, порошкоподібні препарати, розчинні гранули, гранули для розкидання, концентрати у вигляді суспензій, натуральні продукти, просочені активним інгредієнтом, штучні речовини, просочені активним інгредієнтом, добрива, а також засоби, мікроінкапсульовані в полімерних речовинах. Застосування здійснюється звичним способом, наприклад, за допомогою поливу, розпилення, дрібнодисперсного розпилення, використання в ящиках для розсади, розкидання, розпорошування, нанесення піни, розподілення по поверхні тощо. Також можливо використовувати активні інгредієнти способом із використанням наднизького об'єму або вводити препарат активного інгредієнта або сам активний інгредієнт у ґрунт. Також можна обробляти насінини рослин.

Активні інгредієнти можуть бути додатково перетворені на наносклад для подальшого поліпшення розчинності у воді, термовитривалості, біодоступності, органолептичних властивостей і фізіологічних показників.

До того ж вибір типу складу залежатиме від конкретного застосування.

Указані склади можуть бути одержані відомим *per se* способом, наприклад, шляхом змішування активних інгредієнтів із щонайменше одним звичайним наповнювачем, розчинником або розріджувачем, емульгатором, диспергувальною речовиною та/або зв'язувальною або фіксувальною речовиною, змочувальною речовиною, водовідштовхувальним засобом, за потреби осушниками та УФ-стабілізаторами та за потреби барвниками і пігментами, протиспінювачами, консервантами, вторинними загусниками, клейкими речовинами, гіберелінами, а також іншими допоміжними речовинами для обробки.

Даний винахід включає не лише склади, які вже готові до застосування і можуть бути нанесені за допомогою відповідних приладів на рослину або насінину, але також комерційні концентрати, які необхідно розводити водою перед застосуванням.

Застосовуваними допоміжними речовинами можуть бути такі речовини, які є придатними для надання певних властивостей самій композиції та/або препаратам, одержуваним з неї (наприклад, рідинам для розпилення, засобам для протруювання насіння), таких як певні технічні властивості та/або також конкретні біологічні властивості. Типові допоміжні речовини включають наповнювачі, розчинники та носії.

Придатними наповнювачами є, наприклад, вода, полярні й неполярні органічні хімічні рідини, наприклад, із класів ароматичних і неароматичних вуглеводнів (таких як парафіни, алкілбензоли, алкілнафталени, хлорбензоли), спирти і поліоли (які необов'язково також можуть бути заміщеними, етерифікованими та/або естерифікованими), кетони (такі як ацетон, циклогексанон), естери (включаючи жири й олії) і (полі)етери, незаміщені й заміщені аміни, аміди, лактами (такі як N-алкілпіролідони) і лактони, сульфони і сульфоксиди (такі як диметилсульфоксид).

Під зрідженими газоподібними наповнювачами або носіями розуміють рідини, які перебувають у газоподібному стані за стандартної температури та стандартного тиску, наприклад, аерозольні пропеленти, такі як галогенвуглеводні, або ж бутан, пропан, азот і діоксид вуглецю.

У складі можна застосовувати підсилювачі клейкості, такі як карбоксиметилцелюлоза, натуральні й штучні полімери у формі порошків, гранул або латексів, такі як аравійська камедь, полівініловий спирт і полівінілацетат, або ж природні фосфоліпіди, такі як цефаліні і лецитини, і штучні фосфоліпіди. Додатковими допоміжними

речовинами можуть бути мінеральні масла, рослинні олії та метильовані олії з насіння.

Якщо як наповнювач застосовується вода, то також можна застосовувати, наприклад, органічні розчинники як допоміжні розчинники. Застосовними рідкими розчинниками є здебільшого ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад нафтові фракції, спирти, такі як бутанол або гліколь та їхні етери й естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, такі як диметилформамід і диметилсульфоксид, або ж вода.

Композиції, які містять сполуки формули (I), можуть додатково містити інші компоненти, наприклад поверхнево-активні речовини. Придатними поверхнево-активними речовинами є емульгатори та/або піноутворювачі, диспергувальні речовини або змочувальні речовини, які характеризуються іонними або неіонними властивостями, або суміші таких поверхнево-активних речовин. Прикладами таких речовин є солі поліакрилової кислоти, солі лігносульфонової кислоти, солі фенолсульфонової кислоти або нафталенсульфонової кислоти, поліконденсати етиленоксиду з жирними спиртами, або з жирними кислотами, або з жирними амінами, заміщені феноли (переважно алкілфеноли або арилфеноли), солі сульфобурштинових естерів, похідні таурину (переважно алкілтаурати), естери фосфорної кислоти та поліетоксированих спиртів або фенолів, естери жирних кислот і поліолів та похідні сполук, що містять сульфати, сульфонати і фосфати, наприклад етери алкіларилу та полігліколю, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, гідролізати білків, відпрацьовані розчини з лігносульфітом і метилцелюлоза. Наявність поверхнево-активної речовини є обов'язковою, якщо один з активних інгредієнтів та/або один з інертних носіїв є нерозчинними у воді, і коли застосування здійснюють у воді. Пропорція поверхнево-активних речовин становить 5-40 % за вагою композиції за даним винаходом.

Даний винахід також стосується агрохімічних композицій, що містять допоміжну речовину та щонайменше одну сполуку формули (I) за даним винаходом.

Агрохімічна композиція містить фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I). Термін "ефективна кількість" позначає кількість композиції або сполук формули (I), яка є достатньою для контролю шкідливих грибів на вирощуваних рослинах або для захисту матеріалів та яка не викликає суттєвого ушкодження оброблюваних рослин. Така кількість може варіюватися у широкому діапазоні та залежить від різноманітних факторів, таких як вид гриба, контроль якого має здійснюватися, оброблювана вирощувана рослина або матеріал, кліматичні умови та конкретна застосовувана сполука формули (I).

Сполуки формули (I), їхні оксиди та солі можна перетворювати на звичайні типи агрохімічних композицій, наприклад розчини, емульсії, суспензії, пилоподібні форми, порошки, пасти, гранули, пресовані форми, капсули та їх суміші. Приклади типів композицій являють собою суспензії (наприклад, SC, OD, FS), придатні для емульгування концентрати (наприклад, EC), емульсії (наприклад, EW, EO, ES, ME), капсули (наприклад, CS, ZC), пасти, пастилки, змочувані порошки або пилоподібні форми (наприклад, WP, SP, WS, DP, DS), пресовані форми (наприклад, BR, TB, DT), гранули (наприклад, WG, SG, GR, FG, GG, MG), інсектицидні вироби (наприклад, LN), а також гелеподібні склади для обробки матеріалів для розмноження рослин, таких як насіння (наприклад, GF). Такі та додаткові типи композицій визначені в "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 61h Ed. May 2008, CropLife International.

Композиції одержують відомим способом, таким як описаний Mollet and Grube mann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; або Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, TandF Informa, London, 2005.

Придатні допоміжні речовини являють собою розчинники, рідкі носії, тверді носії або наповнювачі, поверхнево-активні речовини, диспергувальні речовини, емульгатори, змочувальні речовини, допоміжні засоби, солубілізатори, засоби, що посилюють проникання, захисні колоїди, адгезійні засоби, загусники, зволожувальні засоби, відлякувальні речовини, приваблювальні речовини, стимулятори поїдання, засоби, що забезпечують сумісність, бактерицидні речовини, засоби, що запобігають заморожуванню, засоби, що запобігають спінюванню, забарвлювальні речовини, речовини, що підвищують клейкість, та зв'язувальні речовини.

Придатні розчинники та рідкі носії являють собою воду та органічні розчинники, такі як фракції мінерального масла від середньої до високої точки кипіння, наприклад гас, дизельне масло; олії рослинного або тваринного походження; аліфатичні, циклічні та ароматичні вуглеводні, наприклад толуол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни; спирти, наприклад етанол, пропанол, бутанол, бензиловий спирт, циклогексанол; гліколі; DMSO; кетони, наприклад циклогексанон; естери, наприклад лактати, карбонати, естери жирних кислот, гамма-бутиролактон; жирні кислоти; фосфонати; аміни; аміді, наприклад N-метилпіролідон, диметиламіди жирних кислот; та їх суміші.

Придатні тверді носії або наповнювачі являють собою неорганічні речовини, наприклад силікати, силікагелі, тальк, каоліни, вапняк, вапно, крейду, глини, доломіт, діатомову землю, бентоніт, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію; полісахариди, наприклад целюлозу, крохмаль; добрива, наприклад сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини; продукти рослинного походження, наприклад борошно зі злакових культур, борошно з кори дерев, борошно з деревини, борошно з горіхової шкаралупи та їх суміші.

Придатні поверхнево-активні речовини являють собою поверхнево-активні сполуки, такі як аніонні, катіонні, неіонні та амфотерні поверхнево-активні речовини, блок-співполімери, поліелектроліти та їх суміші. Такі поверхнево-активні речовини можна застосовувати як емульгатор, диспергувальну речовину, солубілізатор, змочувальну речовину, засіб, що посилює проникання, захисний колоїд або допоміжний засіб. Приклади поверхнево-активних речовин перераховані в McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers and Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.).

Придатні аніонні поверхнево-активні речовини являють собою солі лужних, лужноземельних металів або амонію сульфонатів, сульфатів, фосфатів, карбоксилатів та їх суміші. Приклади сульфонатів являють собою алкіларилсульфонати, дифенілсульфонати, альфа-олефісульфонати, лігнінсульфонати, сульфонати жирних

кислот та масел, сульфонати етоксированих алкілфенолів, сульфонати алкоксированих арилфенолів, сульфонати конденсованих нафталінів, сульфонати додецил- та тридецилбензолів, сульфонати нафталінів та алкілнафталінів, сульфосукцинати або сульфосукцинамиди. Приклади сульфатів являють собою сульфати жирних кислот та масел, етоксированих алкілфенолів, спиртів, етоксированих спиртів або естерів жирних кислот. Приклади фосфатів являють собою фосфатні естери. Приклади карбоксилатів являють собою алкілкарбоксилати та карбоксировані спирти або алкілфенолетоксилати.

Придатні неіонні поверхнево-активні речовини являють собою алкоксилати, N-заміщені аміді жирних кислот, оксиди амінів, естери, поверхнево-активні речовини на основі цукрів, полімерні поверхнево-активні речовини та їх суміші. Приклади алкоксилатів являють собою сполуки, такі як спирти, алкілфеноли, аміни, аміді, арилфеноли, жирні кислоти або естери жирних кислот, які були алкоксировані 1–50 еквівалентами. Оксид етилену та/або оксид пропілену можна застосовувати для здійснення алкоксидування, переважно оксид етилену. Приклади N-заміщених амідів жирних кислот являють собою глюкаміді жирних кислот або алканоламіді жирних кислот. Приклади естерів являють собою естери жирних кислот, естери гліцерину або моногліцериди. Приклади поверхнево-активних речовин на основі цукрів являють собою сорбітани, етоксировані сорбітани, естери сахарози та глюкози або алкілполіглюкозиди. Приклади полімерних поверхнево-активних речовин являють собою гомо- або співполімери вінілпіролідону, вінілові спирти або вінілацетат.

Придатні катіонні поверхнево-активні речовини являють собою четвертинні поверхнево-активні речовини, наприклад сполуки четвертинного амонію з однією або двома гідрофобними групами, або солі довголанцюгових первинних амінів. Придатні амфотерні поверхнево-активні речовини являють собою алкілбетаїни та імідазоліни. Придатні блок-полімери являють собою блок-співполімери типу A-B або A-B-A, що містять блоки, що складаються з оксиду поліетилену та оксиду поліпропілену, або типу A-B-C, що містять алканол, оксид поліетилену та оксид поліпропілену.

Придатні поліелектроліти являють собою полікислоти або поліоснови. Приклади полікислот являють собою солі лужних металів і поліакрилової кислоти або гребенеподібні полімери полікислоти. Приклади поліоснов являють собою полівініламіни або поліетиленаміни.

Придатні допоміжні засоби являють собою сполуки, які характеризуються незначною або навіть відсутньою пестицидною активністю самі по собі та які покращують біологічну ефективність сполуки формули (I) щодо мішені. Приклади являють собою поверхнево-активні речовини, мінеральні масла або рослинні олії та інші допоміжні речовини. Додаткові приклади перераховані Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, TandF Informa UK, 2006, chapter 5.

Придатні загусники являють собою полісахариди (наприклад, ксантанову камедь, карбоксиметилцелюлозу), неорганічні глини (органічно модифіковані або немодифіковані), полікарбоксилати та силікати.

Придатні бактерицидні речовини являють собою похідні бронополу та ізотіазолінону, такі як алкілізотіазолінони та бензізотіазолінони.

Придатні засоби, що запобігають заморожуванню, являють собою етиленгліколь, пропіленгліколь, сечовину та гліцерин. Придатні засоби, що запобігають спінюванню, являють собою силікони, довголанцюгові спирти та солі жирних кислот. Придатні забарвлювальні речовини (наприклад, у червоний, синій або зелений колір) являють собою пігменти з низькою розчинністю у воді та водорозчинні барвники. Приклади являють собою неорганічні забарвлювальні речовини (наприклад, оксид заліза, оксид титану, гексаціаноферат заліза) та органічні забарвлювальні речовини (наприклад, забарвлювальні речовини на основі алізарин-, азо- та фталоціаніну).

Придатні речовини, що підвищують клейкість, або зв'язувальні речовини являють собою полівінілпіролідони, полівінілацетати, полівінілові спирти, поліакрилати, біологічні або синтетичні воски та етери целюлози.

Приклади типів композицій та їх одержання являють собою наступні.

i) Водорозчинні концентрати (SL, LS)

10–60 ваг. % сполуки формули (I) та 5–15 ваг. % змочувального засобу (наприклад, алкоксилатів спирту) розчиняють у воді та/або у водорозчинному розчиннику (наприклад, спиртах) до 100 ваг. %. Активна речовина розчиняється під час розведення водою.

ii) Здатні до диспергування концентрати (DC)

5–25 ваг. % сполуки формули (I) та 1–10 ваг. % диспергувальної речовини (наприклад, полівінілпіролідону) розчиняють в органічному розчиннику (наприклад, циклогексаноні) до 100 ваг. %. За допомогою розведення водою одержують дисперсію.

iii) Здатні до емульгування концентрати (EC)

15–70 ваг. % сполуки формули (I) та 5–10 ваг. % емульгаторів (наприклад, додецилбензолсульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії) розчиняють у нерозчинному у воді органічному розчиннику (наприклад, ароматичному вуглеводні) до 100 ваг. %. За допомогою розведення водою одержують емульсію.

iv) Емульсії (EW, EO, ES)

5–40 ваг. % сполуки формули (I) та 1–10 ваг. % емульгаторів (наприклад, додецилбензолсульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії) розчиняють у 20–40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника (наприклад, ароматичного вуглеводню). Дану суміш вносять у воду до 100 ваг. % за допомогою приладу для емульгування та перетворюють на гомогенну емульсію. За допомогою розведення водою одержують емульсію.

v) Суспензії (SC, OD, FS)

У шаровому млині з перемішувальним механізмом 20–60 ваг. % сполуки формули (I) тонко подрібнюють із додаванням 2–10 ваг. % диспергувальних речовин та змочувальних засобів (наприклад, лігносульфонату натрію та етоксилату спирту), 0,1–2 ваг. % загусника (наприклад, ксантанової камеді) та води до 100 ваг. % з одержанням тонкоподрібненої суспензії активної речовини. За допомогою розведення водою одержують стійку суспензію активної речовини. Для композиції типу FS додають не більше ніж 40 ваг. % зв'язувальної речовини (наприклад, полівінілового спирту).

vi) Здатні до диспергування водою гранули та водорозчинні гранули (WG, SG)

50–80 ваг. % сполуки формули (I) тонко подрібнюють із додаванням диспергувальних речовин та змочувальних засобів (наприклад, лігносульфонату натрію та етоксилату спирту) до 100 ваг. % та одержують у вигляді здатних до диспергування у воді або водорозчинних гранул за допомогою технічних електричних побутових приладів (наприклад, екструзії, вежі з розпилювальним зрошенням, псевдозрідженого шару). За допомогою розведення водою одержують стійку дисперсію або розчин активної речовини.

vii) Здатні до диспергування водою порошки та водорозчинні порошки (WP, SP, WS)

50–80 ваг. % сполуки формули (I) подрібнюють у роторно-статорному млині з додаванням 1–5 ваг. % диспергувальних речовин (наприклад, лігносульфонату натрію), 1–3 ваг. % змочувальних засобів (наприклад, етоксилату спирту) та твердого носія (наприклад, силікагелю) до 100 ваг. %. За допомогою розведення водою одержують стійку дисперсію або розчин активної речовини.

viii) Гель (GW, GF)

У шаровому млині з перемішувальним механізмом 5–25 ваг. % сполуки формули (I) подрібнюють із додаванням 3–10 ваг. % диспергувальних речовин (наприклад, лігносульфонату натрію), 1–5 ваг. % загусника (наприклад, карбоксиметилцелюлози) та води до 100 ваг. % з одержанням тонкоподрібненої суспензії активної речовини. За допомогою розведення водою одержують стійку суспензію активної речовини.

ix) Мікроемульсія (ME)

5–20 ваг. % сполуки формули (I) додають до 5–30 ваг. % суміші органічних розчинників (наприклад, диметиламиду жирної кислоти та циклогексанону), 10–25 ваг. % суміші поверхнево-активних речовин (наприклад, етоксилату спирту та арилфенолетоксилату) та води до 100 %. Дану суміш перемішують протягом 1 г зі спонтанним одержанням термодинамічно стійкої мікроемульсії.

x) Мікрокапсули (CS)

Масляну фазу, що містить 5–50 ваг. % сполуки формули (I), 0–40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника (наприклад, ароматичного вуглеводню), 2–15 ваг. % акрилових мономерів (наприклад, метилметакрилату, метакрилової кислоти та ді- або триакрилату), диспергують у водний розчин захисного колоїду (наприклад, полівінілового спирту). Радикальна полімеризація зумовлює утворення мікрокапсул полі(мет)акрилату. Альтернативно масляну фазу, що містить 5–50 ваг. % сполуки формули (I) за даним винаходом, 0–40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника (наприклад, ароматичного вуглеводню) та мономер ізоціанату (наприклад, дифенілметен-4,4'-діізоціанату) диспергують у водний розчин захисного колоїду (наприклад, полівінілового спирту). Додавання поліаміну (наприклад, гексаметилендіаміну) зумовлює утворення мікрокапсул полісечовини. Кількість мономерів становить не більше ніж 1–10 ваг. %. Ваг. % стосується загальної композиції CS.

xi) Здатні до пилоутворення порошки (DP, DS)

1–10 ваг. % сполуки формули (I) тонко подрібнюють та ретельно змішують із твердим носієм (наприклад, тонкоподрібненим каоліном) до 100 ваг. %.

xii) Гранули (GR, FG)

0,5–30 ваг. % сполуки формули (I) тонко подрібнюють та з'єднують із твердим носієм (наприклад, силікатом) до 100 ваг. %. Здійснюють грануляцію за допомогою екструзії, висушування розпиленням або псевдозрідженого шару.

xiii) Рідини наднизького об'єму (UL)

1–50 ваг. % сполуки формули (I) розчиняють в органічному розчиннику (наприклад, ароматичному вуглеводні) до 100 ваг. %.

Композиції типів i) – xiii) можуть необов'язково містити додаткові допоміжні речовини, такі як 0,1–1 ваг. % бактерицидних речовин, 5–15 ваг. % засобів, що запобігають заморожуванню, 0,1–1 ваг. % засобів, що запобігають спінюванню, та 0,1–1 ваг. % забарвлювальних речовин.

Агрохімічні композиції загалом містять від 0,01 до 95 %, переважно від 0,1 до 90 % та, зокрема, від 0,5 до 75 % за вагою активної речовини.

Активні речовини використовують за чистоти від 90 % до 100 %, переважно від 95 % до 100 % (відповідно до спектра ЯМР).

Для цілей обробки матеріалів для розмноження рослин, зокрема насіння, зазвичай застосовують розчини для обробки насіння (LS), суспоемульсії (SE), текучі концентрати (FS), порошки для сухої обробки (DS), здатні до диспергування у воді порошки для обробки за допомогою зависі (WS), водорозчинні порошки (SS), емульсії (ES), здатні до емульгування концентрати (EC) та гелі (GF). Композиції, що розглядаються, після дво – десятикратного розведення забезпечують концентрації активної речовини, що становлять від 0,01 до 60 % за вагою, переважно від 0,1 до 40 %, в препаратах, готових до застосування. Застосування можна здійснювати до або під час висівання. Способи застосування сполуки формули (I) та композицій на її основі, відповідно, щодо матеріалу для розмноження рослин, особливо насіння, включають протруювання, нанесення покриття, дражування, нанесення пилу та просочування, а також способи застосування щодо борозни. Переважно сполуку формули (I) або композиції на її основі, відповідно, застосовують щодо матеріалу для розмноження рослин за допомогою способу так, щоб не відбувалась індукція проростання, наприклад шляхом протруювання, дражування, нанесення покриття та нанесення пилу щодо насінини.

Якщо застосовувати для захисту рослин кількості застосовуваних активних речовин становлять від 0,001 до 2 кг на га, переважно від 0,005 до 2 кг на га, більш переважно від 0,05 до 0,9 кг на га та, зокрема, від 0,1 до 0,75 кг на га, залежно від типу необхідного ефекту.

Під час обробки матеріалів для розмноження рослин, таких як насінини, наприклад, за допомогою нанесення пилу, нанесення покриття або просочування насінини зазвичай потребуються кількості активної речовини, що становлять від 0,1 до 1000 г, переважно від 1 до 1000 г, більш переважно від 1 до 100 г та найбільш переважно від 5 до 100 г на 100 кілограмів матеріалу для розмноження рослин (переважно насіння).

Під час використання для захисту матеріалів або продуктів, які зберігаються, кількість застосовуваної активної речовини залежить від типу ділянки застосування та необхідного ефекту. Кількості, зазвичай застосовувані для захисту матеріалів, становлять від 0,001 г до 2 кг, переважно від 0,005 г до 1 кг активної речовини на метр кубічний оброблюваного матеріалу.

Можна додавати різноманітні типи масел, змочувальних речовин, допоміжних засобів, добрив або поживних мікроелементів та додаткових пестицидів (наприклад, гербіцидів, інсектицидів, фунгіцидів, регуляторів росту, антидотів, біопестицидів) до активних речовин або композицій, що містять їх як попередньо змішану суміш, або, якщо необхідно, тільки безпосередньо перед застосуванням (бакова суміш). Такі засоби можна змішувати з композиціями за даним винаходом у ваговому співвідношенні, що становить від 1:100 до 100:1, переважно від 1:10 до 10:1.

Пестицид загалом являє собою хімічний або біологічний засіб (такий як пестицидний активний інгредієнт, сполука, композиція, вірус, бактерія, протимікробна речовина або дезинфікувальна речовина), який своїм впливом відлякує, нейтралізує, вбиває або іншим чином перешкоджає шкідникам. Цільові шкідники можуть включати комах, патогени рослин, бур'яни, молюски, птахів, ссавців, риб, нематод (круглих черв'яків) та мікроорганізмів, які руйнують власність, зумовлюють шкоду, поширюють хвороби або є переносниками хвороби. Термін "пестициди" включає також регулятори росту рослин, які змінюють очікувані швидкість росту, цвітіння або розмноження рослини; дефоліанти, які зумовлюють опадання листків або інших листяних частин з рослини, зазвичай для полегшення збору врожаю; висушувальні засоби, які сприяють висушуванню живих тканин, таких як небажані верхівки рослин; активатори рослин, які активують фізіологічні властивості рослини для захисту від певних шкідників; антидоти, які знижують небажану гербіцидну дію пестицидів щодо культурних рослин; та речовини, що сприяють росту рослин, які впливають на фізіологічні властивості рослини для підвищення росту, біомаси, врожаю рослини або будь-яких інших параметрів якості врожаю культурної рослини.

Біопестициди були визначені як форма пестицидів на основі мікроорганізмів (бактерій, грибів, вірусів, нематод тощо) або природних продуктів (сполук, таких як метаболіти, білки або екстракти з біологічних або інших природних джерел) (агенція з охорони довкілля США: <http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>). Біопестициди типово створюють шляхом вирощування та концентрування організмів, що зустрічаються в природі, та/або їхніх метаболітів, включаючи бактерій та інших мікроорганізмів, грибів, вірусів, нематод, білків тощо. Вони часто вважаються важливими компонентами програм комплексної боротьби зі шкідниками (IPM).

Біопестициди поділяють на два основних класи, пестициди на основі мікроорганізмів та біохімічні пестициди.

1. Пестициди на основі мікроорганізмів складаються з бактерій, грибів або вірусів (та часто включають метаболіти, які виробляють бактерії та гриби). Ентомопатогенні нематоди також класифікують як пестициди на основі мікроорганізмів, незважаючи на те, що вони багатоклітинні.

2. Біохімічні пестициди являють собою речовини, що зустрічаються в природі, які здійснюють контроль шкідників або забезпечують інші види застосування для захисту, визначені нижче, але вони є відносно нетоксичними для ссавців.

Користувач зазвичай застосовує композицію за даним винаходом за допомогою пристрою з попереднім дозуванням, ранцевого обприскувача, бака для обприскування, літака для обприскування або іригаційної системи. Зазвичай агрохімічну композицію готують із додаванням води, буфера та/або додаткових допоміжних речовин для забезпечення необхідної концентрації для застосування, та у такий спосіб одержують готові до застосування розчин для обприскування або агрохімічну композицію за даним винаходом. Зазвичай застосовують від 20 до 2000 літрів, переважно від 50 до 500 літрів готового до застосування розчину для обприскування на гектар сільськогосподарської корисної площі.

Даний винахід додатково стосується композиції для контролю небажаних мікроорганізмів, що містить щонайменше одну зі сполук формули (I) та/або одну або більше активних сумісних сполук, вибраних із фунгіцидів, бактерицидних речовин, акарицидів, інсектицидів, нематодцидів, гербіцидів, біопестицидів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, добрив та/або їх сумішей.

Загалом сполуку за даним винаходом застосовують у формі композиції (наприклад, складу), що містить носій. Сполуку за даним винаходом та композиції на її основі можна застосовувати у різноманітних формах, таких як аерозольний розпилювач, капсульна суспензія, концентрат холодного туману, здатний до утворення пилу порошок, здатний до емульгування концентрат, емульсія масла у воді, емульсія вода в маслі, інкапсульована гранула, тонкоподрібнена гранула, текучий концентрат для обробки насіння, газ (під тиском), газоутворювальний продукт, гранула, концентрат гарячого туману, макрогранула, мікрогранула, диспергований у маслі порошок, текучий концентрат, що змішується з маслом, рідина, що змішується з маслом, паста, стрижень для рослин, порошок для сухої обробки насіння, насінна, покрита пестицидом, розчинний концентрат, розчинний порошок, розчин для обробки насіння, концентрат суспензії (текучий концентрат), рідина наднизького об'єму (ulv), суспензія наднизького об'єму (ulv), здатні до диспергування у воді гранули або таблетки, здатний до диспергування у воді порошок для обробки за допомогою зависі, водорозчинні гранули або таблетки, водорозчинний порошок для обробки насіння та змочуваний порошок.

Склад типово містить рідкий або твердий носій та необов'язково одну або більше звичайних допоміжних речовин для складів, які можуть бути твердими або рідкими допоміжними речовинами, наприклад неепоксидовані або епоксидовані рослинні олії (наприклад епоксидовані кокосова олія, рапсова олія або соєва олія), протиспінювачі, наприклад силіконові масла, консерванти, глини, неорганічні сполуки, регулятори в'язкості, поверхнево-активну речовину, зв'язувальну речовину та/або речовини, що підвищують клейкість. Композиція також може додатково містити добрива, донор поживних мікроелементів або інші препарати, які впливають на ріст рослин, а також містити комбінацію, що містить сполуку за даним винаходом з одним або більше іншими біологічно активними засобами, такими як бактерицидні речовини, фунгіциди, нематодциди, активатори рослин, акарициди та інсектициди.

Відповідно, даний винахід також забезпечує композицію, що містить сполуку за даним винаходом та

агрономічний носій та необов'язково одну або більше звичайних допоміжних речовин для складів.

Композиції одержують способом, відомим per se, за відсутності допоміжних речовин, наприклад, шляхом подрібнювання, просіювання та/або пресування твердої сполуки за даним винаходом та у присутності щонайменше однієї допоміжної речовини, наприклад, шляхом ретельного змішування та/або подрібнювання сполуки за даним винаходом із допоміжною(-ими) речовиною(-ами). У випадку твердих сполук за даним винаходом подрібнювання/розмелювання сполук призначене для забезпечення конкретного розміру частинок. Такі способи одержання композицій та застосування сполук за даним винаходом для одержання таких композицій також є об'єктами даного винаходу.

Композиції містять від 0,1 до 99 %, зокрема від 0,1 до 95 % сполуки за даним винаходом та від 1 до 99,9 %, зокрема від 5 до 99,9 % щонайменше одного твердого або рідкого носія, як правило, можливо, що від 0 до 25 %, зокрема від 0,1 до 20 % композиції являють собою поверхнево-активні речовини (% у кожному випадку означає процент за вагою). При цьому концентровані композиції є переважними для комерційних товарів, кінцевий споживач, як правило, застосовує розведені композиції, які містять суттєво нижчі концентрації активного інгредієнта.

Приклади типів складів для листяних частин рослини для попередньо змішаних композицій являють собою:

GR: гранули	EW: емульсії, масло у воді
WP: змочувані порошки	ME: мікроемульсія
WG: здатні до диспергування у воді гранули (порошки)	SC: водний концентрат суспензії
SG: водорозчинні гранули	CS: водна капсульна суспензія
SL: розчинні концентрати	OD: концентрат суспензії на основі масла та
EC: здатний до емульгування концентрат	SE: водна суспензія.

При цьому приклади типів складів для обробки насіння для попередньо змішаних композицій являють собою:

WS: змочувані порошки для обробки насіння за допомогою завісі	FS: концентрати суспензії для обробки насіння
LS: розчин для обробки насіння	WG: здатні до диспергування у воді гранули та
ES: емульсії для обробки насіння	CS: водна капсульна суспензія.

Приклади типів складів, придатних для композицій бакової суміші, являють собою розчини, розведені емульсії, суспензії або їх суміші та пилоподібні речовини.

Як і у випадку з природою складів, способи застосування, такі як застосування щодо листяної частини рослини, просочування, обприскування, розпилювання, нанесення пилу, розсіювання, нанесення покриття або поливання, вибирають відповідно до призначених цілей та переважних обставин.

Композиції бакової суміші загалом одержують шляхом розведення розчинником (наприклад, води) однієї або більше попередньо змішаних композицій, що містять різні пестициди та необов'язково додаткові допоміжні речовини. Придатні носії та допоміжні засоби можуть бути твердими або рідкими та являють собою речовини, зазвичай застосовувані в технології складання, наприклад природні або відновлені неорганічні речовини, розчинники, диспергувальні речовини, змочувальні засоби, речовини, що підвищують клейкість, загусники, зв'язувальні речовини або добрива.

Загалом склад бакової суміші для застосування щодо листяної частини рослини або ґрунту містить від 0,1 до 20 %, зокрема від 0,1 до 15 % необхідних інгредієнтів та від 99,9 до 80 %, зокрема від 99,9 до 85 % твердих або рідких допоміжних речовин (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжні речовини можуть являти собою поверхнево-активну речовину в кількості, що становить від 0 до 20 %, зокрема від 0,1 до 15 % у залежності від складу бакової суміші. Як правило, попередньо змішаний склад для застосування щодо листяної частини рослини містить від 0,1 до 99,9 %, зокрема від 1 до 95 % необхідних інгредієнтів та від 99,9 до 0,1 %, зокрема від 99 до 5 %, твердого або рідкого допоміжного засобу (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжний засіб може являти собою поверхнево-активну речовину в кількості, що становить від 0 до 50 %, зокрема від 0,5 до 40 % у залежності від попередньо змішаного складу.

Зазвичай склад бакової суміші для застосування для обробки насіння містить від 0,25 до 80 %, зокрема від 1 до 75 % необхідних інгредієнтів та від 99,75 до 20 %, зокрема від 99 до 25 % твердих або рідких допоміжних речовин (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжні речовини можуть являти собою поверхнево-активну речовину в кількості, що становить від 0 до 40 %, зокрема від 0,5 до 30 % у залежності від складу бакової суміші.

Як правило, попередньо змішаний склад для застосування для обробки насіння містить від 0,5 до 99,9 %, зокрема від 1 до 95 % необхідних інгредієнтів та від 99,5 до 0,1 %, зокрема від 99 до 5 %, твердого або рідкого допоміжного засобу (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжний засіб може являти собою поверхнево-активну речовину в кількості, що становить від 0 до 50 %, зокрема від 0,5 до 40 %, у залежності від попередньо змішаного складу, при тому, що комерційні продукти переважно будуть складені як концентрати (наприклад, попередньо змішаної композиції (складу)), кінцевий користувач звичайно буде використовувати розведені склади (наприклад, композицію бакової суміші).

Переважні попередньо змішані склади для обробки насіння являють собою водні концентрати суспензії. Склад можна застосовувати щодо насіння із застосуванням традиційних методик та приладів для обробки, таких як методики псевдозріженого шару, спосіб вальцювого млина, ротостатичні прилади для обробки насіння та барабанні прилади для нанесення покриття. Також можна застосовувати інші способи, такі як фонтануючі шари. Насіння можна попередньо вимірювати перед нанесенням покриття. Після нанесення покриття насіння, як правило, висушують та потім переносять до вимірювального приладу для здійснення вимірювання. Такі

процедури відомі в рівні техніки. Сполуки за даним винаходом, зокрема, придатні для застосування щодо ґрунту та для обробки насіння.

Загалом попередньо змішані композиції за даним винаходом містять від 0,5 до 99,9, зокрема від 1 до 95, переважно від 1 до 50 % за вагою необхідних інгредієнтів та від 99,5 до 0,1, зокрема від 99 до 5 % за вагою твердого або рідкого допоміжного засобу (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжна речовина (або допоміжний засіб) може являти собою поверхнево-активну речовину в кількості, що становить від 0 до 50, зокрема від 0,5 до 40 % за вагою у залежності від ваги попередньо змішаного складу.

Сполука формули (I) у переважному варіанті здійснення незалежно від будь-яких інших варіантів здійснення знаходиться у формі композиції для обробки (або захисту) матеріалу для розмноження рослин, де вказана композиція для захисту матеріалу для розмноження рослин може додатково містити барвник. Композиція або суміш для захисту матеріалу для розмноження рослин також може містити щонайменше один полімер із водорозчинних та здатних до диспергування у воді плівкоутворювальних полімерів, які покращують прилипання активних інгредієнтів до обробленого матеріалу для розмноження рослин, при цьому зазвичай полімер характеризується середньою молекулярною масою, що становить від щонайменше 10000 до приблизно 100000.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб контролю або попередження зараження корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами в сільськогосподарських культурах та/або садових культурах, де вказану сполуку загальної формули (I), її ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи, N-оксиди, S-оксиди або прийнятні з погляду сільського господарства солі, композицію або комбінацію на їх основі, застосовують щодо рослин, щодо насіння рослин, їхніх частин або місця їхнього зростання.

В іншому варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб контролю або попередження фітопатогенних мікроорганізмів у сільськогосподарських культурах та/або садових культурах із застосуванням сполуки формули (I), її ізомерів/структурних ізомерів, стереоізомерів, діастереомерів, енантіомерів, таутомерів, комплексів з металами, поліморфів, N-оксидів, S-оксидів або прийнятних з погляду сільського господарства солей, композиції або комбінації на їх основі, який включає стадію застосування ефективної дози сполуки, або композиції, або комбінації в кількостях, що знаходяться у діапазоні від 1 г до 2 кг на гектар сільськогосподарських та/або садових культур.

У ще одному варіанті здійснення у даному винаході представлений спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, що включає обробку рослин, ґрунту, насіння або матеріалів, які мають бути захищені, за допомогою сполуки формули (I), її ізомерів/структурних ізомерів, стереоізомерів, діастереомерів, енантіомерів, таутомерів, комплексів з металами, поліморфів, N-оксидів, S-оксидів або прийнятних з погляду сільського господарства солей, композиції або комбінації на їх основі.

Приклади способів застосування сполук за даним винаходом та композицій на їхній основі, тобто способів контролю шкідників у галузі сільського господарства, являють собою обприскування, розпилювання, нанесення пилу, нанесення за допомогою пензлика, протруювання, розсіювання або поливання, які слід вибирати відповідно до передбачених цілей переважних обставин.

Одним зі способів застосування в галузі сільського господарства є застосування щодо листяної частини рослин (застосування щодо листяної частини рослини), при цьому можна вибирати частоту та норму застосування відповідно до небезпеки зараження шкідниками або грибами, що розглядаються. Як альтернатива, активний інгредієнт може досягати рослини через кореневу систему (системна дія) шляхом застосування сполуки щодо місця зростання рослини, наприклад шляхом застосування рідкої композиції сполуки щодо ґрунту (шляхом просочування) або шляхом застосування твердої форми сполуки у формі гранул щодо ґрунту (застосування щодо ґрунту). У випадку рослин рису-падді такі гранули можна дозувати в затоплені рисові поля. Застосування сполуки за даним винаходом щодо ґрунту є переважним способом застосування.

Типові норми застосування на гектар загалом становлять від 1 до 2000 г активного інгредієнта на гектар, зокрема від 10 до 1000 г/га, переважно від 10 до 600 г/га, як, наприклад, від 50 до 300 г/га.

Можна застосовувати барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад оксид заліза, оксид титану і прусська блакить, та органічні барвники, такі як алізаринові барвники, азобарвники і метал-фталокіанінові барвники, та мікроелементи, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Додатковими добавками можуть бути ароматизуючі речовини, мінеральні масла або рослинні олії, необов'язково модифіковані олії, воски і поживні речовини (включаючи мікроелементи), такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Додатковими компонентами можуть бути стабілізатори, такі як стабілізатори, що надають витривалості до холоду, консерванти, антиоксиданти, стабілізатори, що надають витривалості до світла, або інші засоби, які покращують хімічну та/або фізичну витривалість.

У разі потреби можуть бути присутні також додаткові компоненти, наприклад захисні колоїди, зв'язувальні речовини, клейкі речовини, загусники, тиксотропні речовини, проникні речовини, стабілізатори, засоби, що зв'язують іон металу в хелатний комплекс, комплексоутворювачі. Загалом активні інгредієнти можна об'єднувати з будь-якою твердою або рідкою добавкою, зазвичай застосовуваною з метою приготування складу.

Склад загалом містить від 0,05 до 99 % за вагою, від 0,01 до 98 % за вагою, переважно від 0,1 до 95 % за вагою, більш переважно від 0,5 до 90 % активного інгредієнта, найбільш переважно від 10 до 70 % за вагою.

Описані вище склади можна застосовувати для контролю небажаних мікроорганізмів, при цьому композиції, які містять сполуки формули (I), застосовують щодо мікроорганізмів та/або їхнього середовища існування.

Сполуки формули (I) за даним винаходом, а також солі, N-оксиди, комплекси з металами, стереоізомери або поліморфи можна застосовувати у тому вигляді, як вони є, або в складах на їх основі, і можна змішувати з відомими учасниками змішування для розширення, наприклад, спектра дії або попередження розвитку стійкості. Застосовні учасники змішування включають, наприклад, відомі фунгіциди, інсектициди, акарициди, нематодциди, біопестициди і бактеріциди. Також можлива суміш з іншими відомими активними інгредієнтами, такими як

гербіциди, або з добривами та регуляторами росту, антидотами та/або хімічними сигнальними речовинами.

Згідно з одним варіантом здійснення окремі компоненти композиції за даним винаходом, такі як частини набору або частини двокомпонентної або трикомпонентної суміші, може змішувати сам користувач в резервуарі для обприскування або будь-яких інших типах посудин, застосовуваних для нанесення (наприклад, барабанні прилади для обробки насіння, обладнання для дражування насіння, ранцевий обприскувач), та, якщо необхідно, можна додавати додаткові допоміжні речовини.

Отже, в одному варіанті здійснення даного винаходу передбачений набір для одержання придатної пестицидної композиції, при цьому набір містить а) композицію, що містить компонент 1), визначений у даному документі, та щонайменше одну допоміжну речовину; та б) композицію, що містить компонент 2), визначений у даному документі, та щонайменше одну допоміжну речовину; та необов'язково с) композицію, що містить щонайменше одну допоміжну речовину та необов'язково додатковий активний компонент 3), визначений у даному документі.

Сполука(-и) формули I, комбінації та композиції на її(їхній) основі, що її(їх) містять, під час застосування як фунгіцидів з іншими фунгіцидами може(можуть) зумовлювати розширення одержуваного фунгіцидного спектра активності або попередження розвитку стійкості до фунгіцидів. Крім того, у багатьох випадках одержують незвичайні ефекти.

Вказане можна одержувати шляхом застосування сполуки(сполук) формули I та щонайменше однієї додаткової пестицидно активної речовини одночасно або сумісно (наприклад, як бакову суміш) або окремо або послідовно, при цьому часовий інтервал між окремими застосуваннями вибирають так, щоб переконатись, що активна речовина, нанесена першою, все ще присутня в ділянці дії в достатній кількості в момент часу застосування додаткової(-их) пестицидно активної(-их) речовини(речовин). Порядок застосування не важливий для здійснення даного винаходу.

Відомі та зареєстровані активні сполуки, такі як фунгіциди, інсектициди, нематоциди, акарициди, біопестициди, гербіциди, антидоти, регулятори росту рослин, антибіотики, добрива та поживні речовини, можна об'єднувати зі щонайменше однією сполукою формули I за даним винаходом. Наприклад, фунгіциди, інсектициди, нематоциди, акарициди, біопестициди, гербіциди, антидоти, регулятори росту рослин, антибіотики, добрива та поживні речовини, розкриті та описані у WO2017076739 (A – O), можна об'єднувати зі сполукою формули I за даним винаходом. Даний винахід також стосується таких комбінацій, що містять сполуку за даним винаходом та активні сумісні сполуки, описані в WO2017076739.

Фунгіциди, інсектициди, нематоциди, акарициди, біопестициди, гербіциди, антидоти, регулятори росту рослин, антибіотики, добрива та поживні речовини, описані в WO2017076739, не відтворюються у даному документі для стислості, та вони включені в даний документ за допомогою посилання як необмежувальні приклади, призначені для об'єднання зі щонайменше однією сполукою формули I за даним винаходом.

Усі рослини і частини рослин можуть бути оброблені згідно з даним винаходом. У даному документі передбачається, що "рослини" означають усі рослини і популяції рослин, такі як бажані та небажані дикорослі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини, що зустрічаються в природі). Культурні рослини можуть являти собою рослини, які можна одержувати за допомогою способів традиційної селекції та оптимізації або за допомогою способів біотехнології та генетичної інженерії або комбінацій таких способів, включаючи трансгенні рослини та включаючи культурні сорти рослин, які охороняються та не охороняються правами селекціонерів.811 Передбачається, що "частини рослин" означають усі частини та органи рослин, розташовані над землею і під нею, такі як паросток, листок, квітка і корінь, приклади яких включають листя, хвою, плодоніжки, стебла, квіти, плодові тіла, плоди й насіння, а також корені, бульби і кореневища. Частини рослин також включають зібраний урожай, а також вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад живці, бульби, кореневища, відсадки і насіння.

В одному варіанті здійснення у даному винаході представлена насіннина, що містить сполуку формули (I), її прийнятні з погляду сільського господарства солі, ізомери/структурні ізомери, стереоізомери, діастереомери, енантіомери, таутомери, комплекси з металами, поліморфи, N-оксиди або S-оксиди, де кількість сполуки формули (I), її ізомерів/структурних ізомерів, стереоізомерів, діастереомерів, енантіомерів, таутомерів, комплексів із металами, поліморфів, N-оксидів, S-оксидів або прийнятих з погляду сільського господарства солей становить від 0,1 г до 10 кг на 100 кг насіння.

Крім того, даний винахід передбачає спосіб обробки насіннини, зокрема насіння (у стані спокою, попередньо обробленого для посіву, попередньо пророщеного або навіть з коренями, що з'явилися, і листям), обробленого щонайменше однією зі сполук формули (I) і композиціями на їхній основі. Насіння за даним винаходом застосовують у способах захисту насіння і рослин, що з'явилися над поверхнею ґрунту, від фітопатогенних шкідливих грибів. У таких способах застосовують обробку насіння щонайменше одним активним інгредієнтом за даним винаходом.

Також бажано оптимізувати кількість застосовуваного активного інгредієнта для забезпечення якомога кращого захисту насіння, пророщуваних рослин і сходів, що з'явилися над поверхнею ґрунту, від атак фітопатогенних грибів, але без ушкодження самих рослин застосовуванням активним інгредієнтом. Зокрема, у способах обробки насіння також повинні враховуватися властиві трансгенним рослинам фенотипи для досягнення оптимального захисту насіннини і пророщуваної рослини із використанням мінімальної кількості композицій для захисту культур.

Тому даний винахід також стосується способу захисту насіння, пророщуваних рослин і сходів, що з'явилися, від атак тварин-шкідників та/або фітопатогенних шкідливих мікроорганізмів шляхом обробки насіння композицією за даним винаходом. Також даний винахід стосується застосування композицій за даним винаходом для обробки насіння з метою захисту насіння, пророщуваних рослин і сходів, що з'явилися, від тварин-шкідників та/або фітопатогенних мікроорганізмів. Також даний винахід стосується насіння, яке було оброблене композицією за даним винаходом для захисту від тварин-шкідників та/або фітопатогенних мікроорганізмів.

Однією з переваг даного винаходу є те, що обробка насіння такими композиціями не лише захищає саме насіння, але й одержані рослини, після того як вони з'явилися над поверхнею ґрунту, від тварин-шкідників та/або фітопатогенних шкідливих мікроорганізмів. Таким чином, безпосередня обробка сільськогосподарської культури під час посіву або незабаром після цього захищає рослини у такій же мірі, як і обробка насіння перед посівом. Також перевагою вважається те, що активні інгредієнти або композиції за даним винаходом можуть також застосовуватися для трансгенного насіння, і в цьому випадку рослина, яка виростає з такого насіння, здатна експресувати білок, дія якого спрямована проти шкідників, пошкодження, зумовленого гербіцидами, або абіотичного стресу. Обробка такого насіння активними інгредієнтами або композиціями за даним винаходом, наприклад інсектицидним білком, може привести в результаті до контролю певних шкідників. Неочікувано, але в цьому випадку може спостерігатися додатковий синергічний ефект, який додатково збільшує ефективність захисту від атак шкідників, мікроорганізмів, бур'янів або абіотичного стресу.

Сполуки формули (I) придатні для захисту насінини будь-якого виду рослин, які застосовуються в сільському господарстві, в теплицях, лісах або в садівництві. Більш конкретно насінини являє собою насінину зернових (таких як пшениця, ячмінь, жито, просо та овес), олійного рапсу, маїсу, бавовнику, сої, рису, картоплі, соняшника, бобів, кави, буряка (наприклад, цукрового буряка і кормового буряка), арахісу, овочів (таких як томат, огірок, види цибулі та цибуля-латук), газонної трави і декоративних рослин. Особливе значення має обробка насінини пшениці, сої, олійного рапсу, кукурудзи і рису.

Як описано нижче, обробка трансгенної насінини активними інгредієнтами або композиціями за даним винаходом має особливо важливе значення. Це стосується насінини рослин, які містять щонайменше один гетерологічний ген, який забезпечує експресію поліпептиду або білка, наприклад, з інсектицидними властивостями. Такі гетерологічні гени в трансгенному насінні можуть походити, наприклад, з мікроорганізмів виду *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* або *Gliocladium*. Такі гетерологічні гени переважно походять від виду *Bacillus*, і в цьому випадку генний продукт є ефективним щодо кукурудзяного метелика та/або західного кукурудзяного жука. Особливо переважно гетерологічні гени походять від *Bacillus thuringiensis*.

У контексті даного винаходу композицію за даним винаходом застосовують щодо насіння, або окремо, або у придатному складі. Переважною є обробка насінини в стані, коли вона є досить стабільною, щоб в ході обробки не завдати їй ушкодження. У цілому насіння може бути оброблене у будь-який час від збору урожаю до деякого часу після посіву. Прийнято застосовувати насінину, яку відокремили від рослини і позбавили від качанів, лущиння, стебел, оболонки, волосків або м'якоті плодів. Наприклад, можна застосовувати насінину, яку зібрали, очистили і висушили до вмісту вологи менше ніж 15 % за вагою. Як альтернатива, також можна використовувати насінину, яка після висушування, наприклад, була оброблена водою, а потім знову висушена, або насіння відразу ж після попередньої обробки для посіву, або насіння, що зберігається в стані після попередньої обробки для посіву, або попередньо пророщене насіння, або насіння, посіяне в лотки для розсади, на стрічки або папір.

Під час обробки насіння зазвичай необхідно переконатися, що вибрані такі кількість композиції за даним винаходом, яку застосовують щодо насінини, та/або кількість додаткових добавок, які не призводять до порушення проростання насінини або дозволяють отримати рослину без пошкоджень. Зокрема, це повинно бути гарантовано у разі активних інгредієнтів, які можуть проявляти фітотоксичний ефект за певних норм застосування.

Сполуки формули (I) можна застосовувати безпосередньо, тобто без будь-яких інших компонентів і без розведення. У цілому переважним є застосування композицій щодо насінини у формі придатного складу. Придатні складі і способи обробки насіння відомі фахівцям в даній галузі. Сполуки формули (I) можуть бути перетворені на звичайні складі, придатні для застосування щодо поверхні насіння, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, зависі, або об'єднані з іншими композиціями для нанесення покриття на насінину, такими як плівкоутворювальні матеріали, матеріали для гранулювання, дрібнодисперсні порошки заліза або інших металів, гранули, матеріал для нанесення покриття на інактивоване насіння, а також ULV-склади (склади наднизького об'єму).

Під час обробки насіння для полегшення пророщування насіння може бути покриті полімером. Полімерне покриття складається зі зв'язувальної речовини, воску і пігменту, а також одного або більше стабілізаторів у кількості, ефективній для стабілізації суспензії. Зв'язувальна речовина може являти собою полімер, вибраний з групи, що складається зі співполімеру вінілацетату та етилену, гомополімеру вінілацетату, співполімеру вінілацетату та акрилової кислоти, вінілакрилу, акрилового полімеру, етилен-вінілхлориду, малеїнового ангідриду вінілового ефіру або бутадієнстиролу. Можуть бути застосовані інші подібні полімери.

Такі складі одержують відомим способом, а саме шляхом змішування активних інгредієнтів або комбінацій активних інгредієнтів зі звичайними добавками, наприклад звичайними наповнювачами і розчинниками або розріджувачами, барвниками, змочувальними речовинами, диспергувальними речовинами, емульгаторами, протиспінювачами, консервантами, вторинними загусниками, клейкими речовинами, гіберелінами, а також водою.

Застосовними барвниками, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі барвники, які є звичними для таких цілей. Можна використати будь-які пігменти, які є помірно розчинними у воді, або барвники, які є розчинними у воді. Приклади включають барвники, відомі під назвами родамін В, С.І. пігмент червоний 112 і С.І. розчинник червоний 1.

Застосовними змочувальними речовинами, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі речовини, які сприяють змочуванню та які традиційно використовуються для складу активних ароматичних інгредієнтів. Переважними для використання є алкілнафталенсульфонати, такі як діізопропіл- або діізобутилнафталенсульфонати.

Застосовними диспергувальними речовинами та/або емульгаторами, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, являються всі неіонні, аніонні та катіонні диспергувальні речовини, які зазвичай використовуються для складу активних ароматичних інгредієнтів.

Переважними для використання є неіонні або аніонні диспергувальні речовини або суміші неіонних або аніонних диспергувальних речовин. До придатних неіонних диспергувальних речовин належать, головним чином, блок-співполімери етиленоксиду та пропіленоксиду, етери алкілфенолу та полігліколю і етери тристирилфенолу та полігліколю, а також їх фосфатовані або сульфатовані похідні. Придатними аніонними диспергувальними речовинами являються лігносульфонати, солі поліактилатної кислоти і конденсати арилсульфонату/формальдегіду.

Протиспінювачами, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі речовини, що пригнічують піну, які традиційно використовуються для складу активних аргохімічних інгредієнтів. Переважними для використання є силіконові протиспінювачі та стеарат магнію.

Консервантами, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі речовини, придатні для таких цілей в аргохімічних композиціях. Приклади включають дихлорфен і напівформаль бензилового спирту.

Вторинними загусниками, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі речовини, придатні для таких цілей в аргохімічних композиціях. Переважні приклади включають похідні целюлози, похідні акрилової кислоти, ксантан, модифіковані глини і високодисперсний діоксид кремнію.

Клейкими речовинами, які можуть бути присутніми в складах для протруювання насіння, придатних згідно з даним винаходом, є всі звичайні зв'язувальні речовини, придатні в продуктах для протруювання насіння. Переважні приклади включають полівінілпіролідон, полівінілацетат, полівініловий спирт і тілозу.

Склади для застосування щодо поверхні насіння, застосовувані відповідно до даного винаходу, можна застосовувати для обробки широкого спектра різновидів насіння безпосередньо або після попереднього розведення водою. Наприклад, концентрати або препарати, які можна одержати з них шляхом розбавлення водою, можуть застосовуватися для протруювання насіння зернових культур, таких як пшениця, ячмінь, жито, овес і тритикале, а також насіння кукурудзи, сої, рису, олійного ріпаку, гороху, бобів, бавовнику, соняшника і буряка, або ж широкого спектра насіння різних овочів. Склади, придатні згідно з даним винаходом, або одержані з них розбавлені препарати також можуть застосовуватися щодо насіння трансгенних рослин. У цьому випадку також можуть виникати додаткові синергічні ефекти за рахунок взаємодії з речовинами, утворюваними шляхом експресії.

Для обробки насіння за допомогою складів, застосовуваних відповідно до даного винаходу, або препаратів, одержаних з них шляхом додавання води, всі установки для змішування, які традиційно використовують для застосування щодо поверхні насіння, є застосовними. Зокрема, у разі застосування щодо поверхні насіння процедура включає внесення насіння в змішувальний апарат, додавання необхідної кількості складів, або без додаткової обробки, або після попереднього розбавлення водою, і перемішування, доки склади рівномірно не розподіляться по насінню. За необхідності після цього проводять операцію висушування.

Сполуки за даним винаходом та композиції на їхній основі також є придатними для захисту матеріалу для розмноження рослин, наприклад насіння, таких як плоди, бульби або зерна, або саджанців, від шкідників вищевказаного типу. Матеріал для розмноження можна обробляти сполукою до висаджуванням, наприклад, насінню можна обробляти до висівання. Як альтернатива, сполуку можна застосовувати щодо зерен насіння (нанесення покриття), або шляхом замочування зерен у рідкій композиції, або шляхом застосування шару твердої композиції. Також можна застосовувати композиції, коли матеріал для розмноження висаджують в ділянку застосування, наприклад щодо посівної борозни під час здійснення посіву. Такі способи обробки матеріалу для розмноження рослин та матеріал для розмноження рослин, оброблених у такий спосіб, являють собою додаткові об'єкти даного винаходу. Типові норми обробки будуть залежати від рослини та шкідника/грибів, контроль яких має здійснюватися, та загалом становлять від 1 до 200 грамів на 100 кг насіння, переважно від 5 до 150 грамів на 100 кг насіння, як, наприклад, від 10 до 100 грамів на 100 кг насіння. Застосування сполук за даним винаходом щодо насіння є переважним способом застосування.

Норма застосування складів, придатних згідно з даним винаходом, може варіюватися у відносно широкому діапазоні. Це визначається конкретним вмістом активних інгредієнтів у складах і насіннях. Норми застосування кожного окремого активного інгредієнта зазвичай становлять від 0,001 до 15 г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 5 г на кілограм насіння.

У разі використання сполук формули (I) як фунгіцидів, норми застосування можуть варіювати в межах відносно широкого діапазону залежно від типу застосування. Норма застосування активного інгредієнта за даним винаходом є наступною:

у разі обробки частин рослини, наприклад листя: від 0,1 до 10000 г/га, переважно від 10 до 1000 г/га, більш переважно від 30 до 300 г/га (у разі застосування шляхом поливу або крапельним способом можна зменшити норму застосування, особливо якщо застосовувати такі інертні речовини, як мінеральна вата або перліт);

у разі обробки насіння: від 0,1 до 200 г на 100 кг насіння, переважно від 1 до 150 г на 100 кг насіння, більш переважно від 2,5 до 25 г на 100 кг насіння, ще більш переважно від 2,5 до 12,5 г на 100 кг насіння;

у разі обробки ґрунту: від 0,1 до 10000 г/га, переважно від 1 до 5000 г/га.

Такі норми застосування вказані лише для прикладу і не є обмежувальними для цілей даного винаходу.

У деяких випадках сполуки формули (I) можуть, за певних концентрацій або норм застосування, також застосовуватися як гербіциди, антидоти, регулятори росту, або засоби для поліпшення властивостей рослин, або як мікробіциди, наприклад, як фунгіциди, протигрибкові препарати, бактерициди, вірициди (включаючи композиції проти віроїдів), або як композиції проти MLO (мікоплазмоподібні організми) і RLO (рикетсієподібні організми).

Сполуки формули (I) втручаються у фізіологічні процеси рослин і тому також можуть застосовуватися як регулятори росту рослин. Регулятори росту рослин можуть чинити різні ефекти щодо рослин. Ефект речовин особливо залежить від часу застосування відносно стадії розвитку рослини, різновиду рослини, а також кількості активного інгредієнта, застосовуваного щодо рослин або їхнього середовища існування, і типу застосування. У

кожному випадку регулятори росту повинні мати певний бажаний вплив на культурні рослини.

Ефекти щодо регулювання росту включають більш раннє проростання, поліпшені характеристики сходження, більш розвинену кореневу систему і/або поліпшений ріст коренів, збільшену здатність до кущування, більш продуктивні відростки, більш раннє цвітіння, збільшені висоту та/або біомасу рослини, укорочення стебел, поліпшення росту пагонів, кількість зерен на колос, кількість колосів на м², кількість підземних пагонів і/або кількість квіток, підвищене відсоткове співвідношення ваги врожаю до повної ваги рослин, більш великі листки, менше мертвих нижніх листків, поліпшений філотаксис, більш раннє дозрівання/більш раннє дозрівання плодів, однорідне дозрівання, збільшену тривалість наливання зерна, кращі параметри дозрівання плодів, більший розмір фруктів/овочів, стійкість до росту пагонів і знижений рівень вилягання.

Збільшена або поліпшена врожайність стосується загальної біомаси на гектар, врожайності на гектар, ваги зерен/плодів, розміру насіння та/або ваги гектолітра, а також поліпшеної якості продукту, що включає:

поліпшену здатність до переробки щодо розподілу розміру (зерна, плоду тощо), однорідне дозрівання, вміст вологи у зерні, кращі параметри розмелювання, кращі параметри вініфікації, кращі параметри пивоваріння, збільшений вихід соку, врожайність, перетравлюваність, число седиментації, число падіння, стабільність стручка, стабільність під час зберігання, поліпшену довжину/міцність/однорідність волокон, збільшену якість молока та/або м'яса тварин, яких годують силосом, адаптацію щодо приготування і смаження;

додатково включає поліпшену конкурентоспроможність, пов'язану з поліпшеною якістю плодів/зерен, поліпшеним розподілом розміру (зерен, плодів тощо), підвищеним терміном зберігання/терміном придатності, твердістю/м'якістю, смаком (ароматом, текстурою тощо), класом (розміром, формою, кількістю плодів тощо), кількістю ягід/фруктів на гілці, хрусткістю, свіжістю, покриттям воском, частотою фізіологічних порушень, кольором тощо;

додатково включає збільшену кількість бажаних інгредієнтів, а саме, вміст білка, жирних кислот, вміст олії, якість олії, склад амінокислот, вміст цукру, кислотність (pH), співвідношення цукру і кислоти (градус за шкалою Брикса), вміст поліфенолів, вміст крохмалю, харчову цінність, вміст/індекс глютену, енергоємність, смак тощо;

і додатково включає зменшену кількість небажаних інгредієнтів, а саме, наприклад, меншу кількість мікотоксинів, меншу кількість афлатоксинів, рівень геосміну, вміст фенольних ароматичних сполук, вміст лаккази, поліфенолоксидаз та пероксидаз, вміст нітратів тощо.

Сполуки, що регулюють ріст рослин, можна застосовувати, наприклад, для уповільнення вегетативного росту рослин. Таке зменшення інтенсивності росту представляє економічний інтерес, наприклад, у випадку з травами, оскільки таким чином можна зменшити частоту скошування трави в декоративних садах, парках та на спортивних спорудах, на узбіччях доріг, в аеропортах або в плодкових культурах. Важливим є також пригнічення росту трав'янистих і деревних рослин на узбіччях доріг і поблизу трубопроводів або підвісних кабелів або, як правило, в районах, де енергійний ріст рослин є небажаним.

Важливим також є використання регуляторів росту для пригнічення поздовжнього росту злакових. Це знижує або повністю усуває ризик вилягання рослин перед збором урожаю. Крім того, регулятори росту у випадку з зерновими можуть забезпечити зміцнення їх стебла, що також протидіє виляганням. Використання регуляторів росту для укорочення та зміцнення стебел дозволяє застосовувати більші об'єми добрив для збільшення врожаю без будь-якого ризику вилягання зернової культури.

У багатьох культурних рослин зменшення інтенсивності вегетативного росту дозволяє щільніше висаджувати рослини, і саме тому можна досягти більш високих врожаїв у розрахунку на поверхню ґрунту. Іншою перевагою нижчих рослин, отриманих таким чином, є те, що таку сільськогосподарську культуру легше вирощувати та збирати.

Зменшення вегетативного росту рослин також може обумовлювати збільшення або поліпшення врожайності, оскільки поживні речовини та асиміляти приносять більше користі для формування квітів і плодів, ніж для вегетативних частин рослин.

Як альтернатива, регулятори росту також можна застосовувати для стимулювання вегетативного росту. Це приносить велику користь при збиранні вегетативних частин рослини. Однак стимулювання вегетативного росту може також стимулювати генеративний ріст, оскільки утворюється більше асимілятів, а це призводить до отримання більших плодів або більшої їх кількості.

Крім того, сприятливого впливу на ріст або врожайність можна досягти за рахунок поліпшення ефективності використання поживних речовин, особливо ефективності використання азоту (N), ефективності використання фосфору (P), ефективності використання води, поліпшеної транспірації, дихання та/або швидкості асиміляції CO₂, кращого утворення бульб, поліпшеного Са-метаболізму тощо.

Аналогічним чином регулятори росту можна застосовувати для зміни складу рослин, що, в свою чергу, може привести до поліпшення якості зібраної продукції. Під впливом регуляторів росту можуть утворюватися партенокарпні плоди. Окрім цього, можна впливати на стать квіток. Також можна забезпечити вироблення стерильного пилку, що має велике значення в селекції та одержанні гібридного насіння.

Використання регуляторів росту дозволяє контролювати розгалуження рослин. З одного боку, порушуючи верхівкове домінування, можна стимулювати розвиток бічних пагонів, що може бути дуже бажаним, особливо у разі вирощування декоративних рослин, також у поєднанні з пригніченням росту. Однак, з іншого боку, можна пригнічувати ріст бічних пагонів. Цей ефект представляє особливий інтерес, наприклад, у разі вирощування тютюну або в разі вирощування томатів.

Під впливом регуляторів росту кількість листків на рослинах можна контролювати таким чином, щоб забезпечити дефоліацію рослин у бажаний час. Така дефоліація відіграє важливу роль у механічному збиранні бавовнику, але також представляє інтерес для полегшення збирання врожаю інших сільськогосподарських культур, наприклад, у виноградарстві. Дефоліація рослин також може бути проведена для зменшення транспірації у рослин перед їх пересадкою.

Крім того, регулятори росту також можуть модулювати старіння рослин, що може приводити до досягнення

тривалого періоду зеленого листя, довшої фази наливу зерна, поліпшеної якості врожаю тощо.

Регулятори росту також можна застосовувати для регулювання розтріскування плодів. З одного боку, можна запобігти передчасному розтріскуванню плодів. З іншого боку, можна сприяти розтріскуванню плодів або навіть передчасному припиненню цвітіння для досягнення бажаної маси ("проріджування"). Крім того, можна застосовувати регулятори росту під час збору врожаю, щоб зменшити сили, необхідні для відривання плодів, з метою забезпечити можливість механічного збору або полегшити збір руками.

Регулятори росту також можна застосовувати для досягнення більш швидкого дозрівання зібраного матеріалу або його затримки перед збором урожаю або після нього. Це має особливу перевагу, оскільки дозволяє оптимально пристосуватися до вимог ринку. Більше того, у деяких випадках регулятори росту можуть забезпечити поліпшення кольору плодів. Крім того, регулятори росту також можна застосовувати для синхронізації дозрівання протягом певного періоду часу. Це створює передумови для повного механічного або ручного збирання врожаю за одну операцію, наприклад, у випадку тютюну, помідорів або кави.

Застосовуючи регулятори росту, можна додатково впливати на спокій насіння або бруньок рослин, завдяки чому такі рослини, як ананас або декоративні рослини в розплідниках, наприклад, проростають, сходять або квітнуть у той час, коли вони зазвичай до цього не схильні. У районах, де існує ризик заморозків, може бути бажаним затримати бутонізацію або проростання насіння за допомогою регуляторів росту, щоб уникнути ушкодження, спричиненого пізніми заморозками.

Нарешті, регулятори росту можуть зумовлювати стійкість рослин до заморозків, посухи або високої солоності ґрунту. Це дозволяє вирощувати рослини в регіонах, які зазвичай непридатні для цієї мети.

Сполуки формули (I) також проявляють сильний зміцнюючий ефект щодо рослин. Відповідно, їх можна застосовувати для мобілізації захисних сил рослини від атаки небажаних мікроорганізмів.

Речовини, що зміцнюють рослини (зумовлюють їх стійкість), у даному контексті є речовинами, здатними стимулювати захисну систему рослин таким чином, що в оброблених рослин внаслідок зараження небажаними мікроорганізмами розвивається високий ступінь стійкості до таких мікроорганізмів.

Крім того, в контексті даного винаходу фізіологічні ефекти рослин включають наступне.

Витривалість щодо абіотичного стресу, що включає витривалість до високих або низьких температур, посухостійкість і відновлення після стресу, спричиненого посухою, ефективність використання води (що співвідноситься зі зменшенням споживання води), витривалість щодо паводків, озонного стресу і витривалість щодо УФ, витривалість щодо хімічних речовин, таких як важкі метали, солі, пестициди тощо.

Витривалість щодо біотичного стресу передбачає підвищену стійкість щодо грибів і підвищену стійкість щодо нематод, вірусів і бактерій. У контексті даного винаходу витривалість щодо біотичного стресу переважно передбачає підвищену стійкість щодо грибів і підвищену стійкість щодо нематод.

Підвищену потужність рослин, що складається зі здоров'я рослини / якості рослини і потужності насіння, зниженої кількості проблем зі стеблостоєм, поліпшеного зовнішнього вигляду, поліпшеного відновлення після періодів стресу, поліпшеної пігментації (наприклад, вміст хлорофілу, ефект збереження зеленого забарвлення і так далі) і поліпшеної ефективності фотосинтезу.

Крім того, сполуки формули (I) можуть зменшувати вміст мікотоксинів у зібраному матеріалі та отриманих з нього продуктах харчування та кормах. Зокрема, до мікотоксинів належать без обмеження наступні: дезоксиніваленон (DON), ніваленон, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, T2- і HT2-токсин, фумонізини, зеараленон, моніліформін, фузарин, діацетоксисцирпенон (DAS), боверицин, еніатин, фузаропроліферин, фузаренон, охратоксини, патулін, алкалоїди ріжків і афлатоксини, одержані, наприклад, з наступних грибів: видів роду *Fusarium*, таких як *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *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* тощо, а також видів роду *Aspergillus*, таких як *A. flavus*, *A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, видів роду *Penicillium*, таких як *P. verrucosum*, *P. viridicatum*, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P. claviforme*, *P. roqueforti*, видів роду *Claviceps*, таких як *C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, видів роду *Stachybotrys* й інших.

Сполуки формули (I) також можна застосовувати для захисту матеріалів, а саме для захисту промислових матеріалів від атаки фітопатогенних грибів та спричиненого ними руйнування.

Крім того, сполуки формули (I) можна застосовувати як композиції, що протидіють обростанню, окремо або в комбінації з іншими активними інгредієнтами.

Передбачається, що "промислові матеріали" означають у даному контексті неживі матеріали, які були одержані для використання в промисловості. Наприклад, промисловими матеріалами, які мають бути захищені за допомогою композицій за даним винаходом від спричинених мікроорганізмами зміни або руйнування, можуть бути клейкі речовини, види клею, папір, шпалери та предмет з картону/картон, текстильні матеріали, килими, шкіра, деревина, волокнисті матеріали та тканини, фарби та пластикові вироби, мастильно-охолоджувальні матеріали та інші матеріали, які можуть бути заражені або зруйновані мікроорганізмами. Частини виробничих установок та будівель, наприклад, контури охолоджувальної води, системи охолодження та опалення, а також вентиляційні та кондиціонерні установки, які можуть бути пошкоджені за рахунок розповсюдження мікроорганізмів, також можуть бути зазначені серед матеріалів, які мають бути захищені. Промислові матеріали, що входять до обсягу даного винаходу, переважно включають клейкі речовини, види клею, папір і картон, шкіру, деревину, фарби, мастильно-охолоджувальні матеріали та рідини для теплопередачі, більш переважно деревину.

Сполуки формули (I) можуть запобігати несприятливим ефектам, таким як гниття, розпад, зміна кольору, знебарвлення або утворення плісняви.

У випадку обробки деревини сполуки формули (I) можна також застосовувати для попередження грибкових хвороб, які зазвичай з'являються на або всередині лісоматеріалів. Термін "лісоматеріали" означає всі типи деревини та всі типи обробки даної деревини, призначені для будівництва, наприклад тверду деревину, деревину

високої міцності-, шарувату деревину та фанеру. Спосіб обробки лісоматеріалів за даним винаходом в основному складається з приведення у контакт з композицією за даним винаходом; це включає, наприклад, пряме застосування, обприскування, занурення, введення або будь-які інші придатні способи.

Крім того, сполуки формули (I) можуть бути використані для захисту об'єктів, які контактують із солоною водою або слабомінералізованою водою, особливо корпусів, екранів, сіток, будівель, причалів та систем сигналізації, від обростання.

Сполуки формули (I) також можуть бути використані для захисту товарів, які зберігаються. Передбачається, що "товари, які зберігаються" означають природні речовини рослинного або тваринного походження або продукти їх переробки, які є природного походження і для яких потрібен довгостроковий захист.

Товари, які зберігаються, рослинного походження, наприклад, рослини або частини рослин, такі як стебла, листя, бульби, насіння, плоди, зерна, можуть піддаватися обробці з метою захисту, будучи щойно зібраними або після обробки шляхом (попереднього) висушування, зволоження, розмелювання, подрібнення, пресування або обсмажування. Товари, які зберігаються, також включають лісоматеріал, при цьому необроблений, такий як будівельний лісоматеріал, електричні стовпи та шлагбауми, або у вигляді готових продуктів, таких як меблі. Товарами, які зберігаються, тваринного походження є, наприклад, шкіра, шкіргалантерейний виріб, хутро та шерсть. Композиції за даним винаходом можуть запобігати несприятливим ефектам, таким як гниття, розпад, зміна кольору, знебарвлення або утворення плісняви.

Мікроорганізми, здатні руйнувати або змінювати промислові матеріали, включають, наприклад, бактерії, гриби, дріжджі, водорості та слизові організми. Сполуки формули (I) переважно діють проти грибів, особливо пліснявих, грибів, які знебарвлюють або руйнують деревину (Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes і Zygomycetes), і проти слизових організмів і водоростей. Приклади включають мікроорганізми наступних родів: *Alternaria*, такі як *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, такі як *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, такі як *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, такі як *Coniophora puetana*; *Lentinus*, такі як *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, такі як *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, такі як *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, такі як *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, такі як *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, такі як *Trichoderma viride*; *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. і *Tyromyces* spp., *Cladosporium* spp., *Paecilomyces* spp., *Mucor* spp., *Escherichia*, такі як *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, такі як *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, такі як *Staphylococcus aureus*, *Candida* spp. і *Saccharomyces* spp., такі як *Saccharomyces cerevisiae*.

Окрім цього, сполуки формули (I) також характеризуються дуже гарними протигрибковими ефектами. Вони характеризуються широким спектром протигрибкової дії, особливо проти дерматофітів і дріжджів, пліснявих і диморфічних грибів (наприклад, проти видів роду *Candida*, таких як *Candida albicans*, *Candida glabrata*), і *Epidermophyton floccosum*, видів роду *Aspergillus*, таких як *Aspergillus niger* і *Aspergillus fumigatus*, видів роду *Trichophyton*, таких як *Trichophyton mentagrophytes*, видів роду *Microsporon*, таких як *Microsporon canis* і *audouinii*. Перерахування таких грибів у жодному разі не є обмеженням охопленого мікотичного спектра і має лише ілюстративний характер.

Сполуки також можна застосовувати для контролю важливих грибових патогенів у галузі рибництва та вилову ракоподібних, наприклад *Saprolegnia diclina* у видів форелі, *Saprolegnia parasitica* у раків.

Отже, сполуки формули (I) можна застосовувати як для медичного, так і для немедичного застосування.

Сполуки формули (I) можуть бути використані у тому вигляді, як їх одержано, у формі складів на їх основі або у вигляді форм, призначених для застосування, одержаних з них, а саме, у вигляді готових до застосування розчинів, суспензій, змочуваних порошків, паст, розчинних порошків, порошкоподібних препаратів і гранул. Застосування проводиться традиційним способом, наприклад, за допомогою поливу, розпилення, дрібнодисперсного розпилення, розкидання, розпорошування, нанесення піни, розподілення по поверхні тощо. Також можна використовувати активні інгредієнти методом наднижнього об'єму або вводити препарат на основі активного інгредієнта / сам собою активний інгредієнт у ґрунт. Також можна обробляти насіння рослин.

Можна обробляти всі рослини та їх частини згідно з даним винаходом, переважно дикорослі види рослин та культурні сорти рослин, або ті, що одержані за допомогою традиційних біологічних методів селекції, таких як схрещування або злиття протопластів, а також їх частини. У додатковому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та культурні сорти рослин, одержані за допомогою методів генної інженерії, при цьому у разі потреби – у поєднанні з традиційними методами (генетично-модифіковані організми), та їх частини. Терміни "частини", або "частини рослини", або "рослинні частини" були роз'яснені вище. Більш переважно культурні сорти рослин, що є у продажу або використовуються, обробляють згідно з даним винаходом. Передбачається, що "культурні сорти рослин" означають рослини, які характеризуються новими властивостями ("ознаками") і були одержані за допомогою традиційної селекції, мутагенезу або за допомогою методик рекомбінантної ДНК. Це можуть бути сорти, різновиди, біо- або генотипи.

Спосіб обробки за даним винаходом можна застосовувати у разі обробки генетично модифікованих організмів (ГМО), наприклад, рослин або насіння. Генетично модифіковані рослини (або трансгенні рослини) – це рослини, гетерологічний ген яких стабільно інтегрований у геном. Вираз "гетерологічний ген" загалом означає ген, який отримано або зібрано за межами рослини і який після введення в ядерний, хлоропластний або мітохондріальний геном забезпечує появу у трансформованої рослини нових або поліпшених агрономічних або інших властивостей в результаті експресії білка або поліпептиду, що становлять інтерес, або в результаті пригнічення або сайленсингу іншого(-их) гена(-ів), які є присутніми в рослині (наприклад, за допомогою технології антисенсових послідовностей, технології спільного пригнічення, технології РНК-інтерференції (RNAi) або технології мікроРНК (miRNA)). Гетерологічний ген, розташований в геномі, також називається трансгеном. Трансген, який визначається його конкретним місцем розташування в геномі рослини, називається трансформацією або трансгенною подією.

Рослини та культурні сорти рослин, які бажано обробляти згідно з даним винаходом, включають усі рослини,

які мають генетичний матеріал, що надає цим рослинам особливо переважних, корисних ознак (чи то вони одержані за допомогою селекції та/або біотехнологічних способів).

Рослини та культурні сорти рослин, які також бажано обробляти згідно з даним винаходом, є стійкими щодо одного або більше біотичних стресів, тобто зазначені рослини демонструють кращий захист від тварин-шкідників та шкідливих мікроорганізмів, таких як нематоди, комахи, кліщі, фітопатогенні гриби, бактерії, віруси та/або віроїди.

Рослини та культурні сорти рослин, які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, являють собою такі рослини, що є стійкими щодо одного або більше абіотичних стресів. Умови абіотичного стресу можуть включати, наприклад, посуху, вплив холодної температури, вплив тепла, осмотичний стрес, паводок, підвищену солоність ґрунту, вплив підвищеного вмісту мінералів, вплив озону, вплив надмірного освітлення, обмежену доступність азотистих поживних речовин, обмежену доступність фосфорних поживних речовин, уникнення тіні.

Рослини та культурні сорти рослин, які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, являють собою такі рослини, що характеризуються підвищеними характеристиками врожайності. Підвищена врожайність у зазначених рослин може бути результатом, наприклад, поліпшених фізіології рослин, росту та розвитку, таких як ефективність використання води, ефективність утримання води, поліпшене використання азоту, посилена асиміляція вуглецю, поліпшений фотосинтез, підвищена ефективність проростання та прискорене дозрівання. Крім того, на врожайність може впливати поліпшена будова рослини (в стресових умовах), включаючи без обмеження раннє цвітіння, контроль цвітіння для одержання гібридного насіння, потужність сходів, розмір рослини, кількість міжвузлів та відстань між ними, ріст коренів, розмір насіння, розмір плодів, розмір стручка, кількість стручків або колосків, кількість насінин на стручок або колос, маса насіння, збільшене заповнення насінням, зменшений розкид насіння, зменшений ступінь розкриття стручків та стійкість до вилягання. Додаткові ознаки врожайності включають склад насіння, такий як вміст вуглеводів та склад, наприклад, бавовни або крохмалю, вміст білка, вміст та склад олії, харчова цінність, зниження антиживильних сполук, поліпшену здатність до переробки та кращу стабільність при зберіганні.

Рослини, які можна обробляти згідно з даним винаходом, являють собою гібридні рослини, у яких вже проявляється характеристика гетеросису або гібридної сили, що загалом приводить до більш високого урожаю, сили, здоров'я та стійкості щодо біотичного та абіотичного стресів.

Рослини або культурні сорти рослин (одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є витривалими щодо гербіцидів рослинами, тобто рослинами, які стали витривалими щодо одного або більше гербіцидів. Такі рослини можуть бути одержані або шляхом генетичної трансформації, або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає таку витривалість щодо гербіцидів.

Рослини або культурні сорти рослин (одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є стійкими до комах трансгенними рослинами, тобто рослинами, які стали стійкими до атак певних цільових комах. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає таку стійкість щодо комах.

Рослини або культурні сорти рослин (одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є витривалими до абіотичних стресів. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає таку стійкість до стресу.

Рослини або культурні сорти рослин (одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, демонструють змінені кількість, якість та/або стабільність під час зберігання зібраного продукту та/або змінені властивості конкретних інгредієнтів в зібраному продукті.

Рослини або культурні сорти рослин (які можуть бути одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є рослинами, такими як рослини бавовнику, зі зміненими характеристиками волокна. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає такі змінені характеристики волокна.

Рослини або культурні сорти рослин (які можуть бути одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є рослинами, такими як олійний ріпак або споріднені рослини роду Brassica, зі зміненими характеристиками профілю олії. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає такі змінені характеристики профілю олії.

Рослини або культурні сорти рослин (які можуть бути одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є рослинами, такими як олійний ріпак або споріднені рослини роду Brassica, зі зміненими характеристиками осипання насіння. Такі рослини можуть бути одержані шляхом генетичної трансформації або шляхом відбору рослин, які містять мутацію, що надає такі змінені характеристики осипання насіння, і включають такі рослини, як олійний ріпак із відтермінованим або зменшеним осипанням насіння.

Рослини або культурні сорти рослин (які можуть бути одержані за допомогою способів біотехнології рослин, таких як генна інженерія), які також можуть бути оброблені згідно з даним винаходом, є рослинами, такими як рослини тютюну, зі зміненими патернами посттрансляційної модифікації білка.

Сполуки за даним винаходом не тільки ефективно здійснюють контроль небажаних фітопатогенних мікроорганізмів, а також демонструють позитивну реакцію у сільськогосподарських культур, таку як ефекти посилення росту рослин, наприклад посилення життєздатності рослини, посилений ріст коренів, посилена стійкість до посух, високого вмісту солі, високої температури, холоду, морозу або світлового випромінювання, поліпшене цвітіння, ефективне використання води та поживних речовин (таке як поліпшене засвоєння азоту),

підвищена якість продукту рослини, більше число продуктивних пагонів, посилена стійкість щодо грибів, комах, шкідників тощо, що приводить до більш високого урожаю.

В одному варіанті здійснення сполуки загальної формули (I), розкриті в даному винаході, є застосовними для застосування в не агрономічних галузях.

ХІМІЧНІ ПРИКЛАДИ

У наступних прикладах викладені процедура і спосіб одержання сполук за даним винаходом без їх обмеження і включений найкращий спосіб, передбачений авторами винаходу, для здійснення даного винаходу.

Приклад 1. Синтез проміжних сполук 3-бромамідину (III)

а) N'-(3-Бром-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід (III)

Стадія 1. Одержання 3-бром-2,5-диметилбензойної кислоти (XXIV)

Суміш 2,5-диметилбензойної кислоти (2 г, 13,3 ммоль) і сірчаної кислоти (20 мл) охолоджували до 0 °C, до реакційної суміші додавали N-бромсукцинімід (2,4 г, 13,3 ммоль) та її перемішували при 0 °C протягом 1,5 год. Після завершення реакції реакційну суміш виливали на подрібнений лід та екстрагували етилацетатом (50 мл). Шар етилацетату промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 50 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 3-бром-2,5-диметилбензойної кислоти (1,6 г, вихід 52 %), LCMS (M-1): 229,00.

Стадія 2. Одержання трет-бутил-(3-бром-2,5-диметилфеніл)карбамату

Реакційну суміш 3-бром-2,5-диметилбензойної кислоти (1 г, 4,3 ммоль), триетиламіну (1,5 мл, 10,9 ммоль) та дифенілфосфорилазиду (1,8 г, 6,5 ммоль) у безводному трет-бутанолі нагрівали при 80 °C протягом 6 год. Після завершення реакції реакційну суміш виливали на подрібнений лід та екстрагували етилацетатом (50 мл). Шар етилацетату промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 50 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням трет-бутил-(3-бром-2,5-диметилфеніл)карбамату (0,9 г, вихід 69 %).

Стадія 3. Одержання 3-бром-2,5-диметиланіліну (XXIII)

До розчину трет-бутил-(3-бром-2,5-диметилфеніл)карбамату (1 г, 3,3 ммоль) у дихлорметані (20 мл) по краплях при 0 °C додавали трифтороцтову кислоту (10 мл, 130 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 6 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений залишок розчиняли в дихлорметані (30 мл) та двічі промивали насиченим розчином бікарбонату натрію (10 мл). Органічний шар розділяли, промивали сольовим розчином, потім висушували над безводним сульфатом натрію та випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 50 % етилацетату як елюенту з одержанням 3-бром-2,5-диметиланіліну (0,45 г, 2,2 ммоль, вихід 67 %). ¹H-NMR (400 МГц, DMSO-d₆) δ 6,59 (s, 1H), 6,42 (s, 1H), 5,10 (s, 2H), 2,11 (s, 3H), 2,09 (s, 3H).

Стадія 4. Одержання N'-(3-бром-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (III)

До перемішаного розчину 3-бром-2,5-диметиланіліну (1,00 г, 5,0 ммоль) у триметилортоформіаті (15 мл) додавали безводний моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,05 г, 0,2 ммоль) та одержану реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °C протягом 4 год. Після завершення реакції розчинник випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт розчиняли в 1,4-діоксані (50 мл) в атмосфері азоту з наступним додаванням N-етилметиламіну (0,9 мл, 10 ммоль). Одержану реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 80 °C протягом 3 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бром-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (1 г, 3,5 ммоль, вихід 71 %). ¹H-NMR (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,62 (brs, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,59 (s, 1H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 270,90.

b) N'-(3-Бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід

Стадія 1. Одержання 1-бром-5-фтор-2-метил-3-нітробензолу

До розчину 4-фтор-1-метил-2-нітробензолу (2,00 г, 12,9 ммоль) у трифтороцтовій кислоті (10 мл) додавали сірчану кислоту (3 мл) при 0 °C із наступним додаванням до реакційної суміші N-бромсукциніміду (2,4 г, 13,3 ммоль) та реакційну суміш перемішували при 0 °C протягом 1,5 год. Після завершення реакції реакційну суміш виливали на подрібнений лід та екстрагували етилацетатом (50 мл). Шар етилацетату промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 1-бром-5-фтор-2-метил-3-нітробензолу (2,2 г, 9,4 ммоль, вихід 73 %) у вигляді жовтої рідини. ¹H-NMR (400 МГц, CDCl₃) δ 7,57 (dd, 1H), 7,50 (dd, 1H), 2,52 (s, 3H); GCMS: 234,9.

Стадія 2. Одержання 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну

До перемішаного розчину 1-бром-5-фтор-2-метил-3-нітробензолу (1,0 г, 4,3 ммоль) у водному розчині етанолу (15 мл, 2:1) додавали залізний порошок (1,7 г, 29,9 ммоль) та хлорид амонію (1,1 г, 21,3 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °C протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °C, фільтрували через шар целюли та ретельно промивали етилацетатом. Об'єднаний фільтрат випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт нейтралізували насиченим водним розчином бікарбонату натрію (25 мл) та тричі екстрагували етилацетатом (50 мл). Об'єднані шари етилацетату промивали водою, сольовим розчином та висушували над безводним сульфатом натрію, випарювали за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну (0,8 г, 3,8 ммоль, вихід 89 %); GCMS: 202,9.

Стадія 3. Одержання N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До перемішаного розчину 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну (1,0 г, 4,9 ммоль) в 1,4-діоксані (10 мл) додавали моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,05 г, 0,2 ммоль) та N-(диметоксиметил)-N-метилетанамін (1,6 г, 12,3

ммоль) та одержану реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °С протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (1 г, 3,5 ммоль, вихід 72 %) у вигляді коричневої рідини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,75 (s, 1H), 7,01 (dd, 1H), 6,74-6,71 (m, 1H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 274,80.

с) N'-(3-Бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід

Стадія 1. Одержання 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу

До перемішуваної суміші 2-бром-4-метил-6-нітроаніліну (2,0 г, 8,7 ммоль), хлориду міді(І) (1,7 г, 17,3 ммоль) в ацетонітрилі (20 мл) по краплях при 0 °С додавали трет-бутильнітрит (2,7 г, 26 ммоль). Після завершення додавання забезпечували перемішування реакційної суміші при 25 °С протягом 1 год. Після завершення реакції реакційну суміш фільтрували через шар целіту, промивали ацетонітрилом. Фільтрат концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт розчиняли в етилацетаті (50 мл), промивали водним розчином хлориду амонію, сольовим розчином та висушували над безводним сульфатом натрію. Розчинник випарювали за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату як елюенту з одержанням 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу (1,6 г, 6,6 ммоль, вихід 76 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 8,02-7,97 (1H), 7,94-7,90 (1H), 2,40-2,37 (3H); GCMS: 252,80.

Стадія 2. Одержання 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну

До перемішуваного розчину 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу (1,00 г, 4 ммоль) у водному розчині етанолу (15 мл, 2:1) додавали залізний порошок (1,6 г, 27,9 ммоль) та хлорид амонію (1,1 г, 20 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °С протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту та ретельно промивали етилацетатом. Об'єднаний фільтрат випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт нейтралізували насиченим водним розчином бікарбонату натрію та тричі екстрагували етилацетатом (50 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою, сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та випарювали за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату як елюенту з одержанням 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну (0,8 г, 3,5 ммоль, вихід 89 %) у вигляді коричневої рідини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 6,73-6,71 (m, 1H), 6,59-6,57 (m, 1H), 5,57 (s, 2H), 2,15 (s, 3H); LCMS (M+1): 222,00.

Стадія 3. Одержання N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До перемішуваного розчину 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну (1,0 г, 4,5 ммоль) в 1,4-діоксані (10 мл) додавали безводний моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,04 г, 0,2 ммоль) та N-(диметоксиметил)-N-метилетанамін (1,5 г, 11,3 ммоль) та одержану суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °С протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,9 г, 3,3 ммоль, вихід 73 %) у вигляді коричневої рідини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,74 (s, 1H), 7,13-7,11 (m, 1H), 6,84-6,78 (m, 1H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 290,80.

Приклад 2. Одержання N'-(3-бензил-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

а) Одержання N'-(2,5-диметил-3-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

Перемішувану суміш N'-(3-бром-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (1,0 г, 3,7 ммоль), біс(пінакол)дибору (1,9 г, 7,4 ммоль), [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) дихлорметану [PdCl₂(dppf)-CH₂Cl₂] (0,2 г, 0,2 ммоль) та ацетату калію (0,7 г, 7,4 ммоль) в 1,4-діоксані (30 мл) дегазували протягом 5 хв. азотом. Реакційну суміш перемішували при 95 °С протягом 16 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли дихлорметаном, фільтрували через шар целіту, залишок промивали дихлорметаном (100 мл). Об'єднаний фільтрат промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію. Леткі речовини видаляли за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(2,5-диметил-3-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,8 г, вихід 70 %).

б) Одержання N'-(3-бензил-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

Суміш N'-(2,5-диметил-3-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,5 г, 1,6 ммоль), (бромметил)бензолу (0,3 г, 1,6 ммоль), Pd(Ph₃)₄ [тетракіс(трифенілфосфін)паладію(0)] (0,09 г, 0,08 ммоль) та карбонату калію (0,5 г, 3,9 ммоль) у суміші діоксан:вода (12 мл, 8:2) дегазували азотом. Реакційну суміш перемішували при 100 °С протягом 4 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту. Фільтрат розбавляли етилацетатом та промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та розчинник видаляли за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бензил-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,4 г, вихід 63 %).

Приклад 3. Одержання N-етил-N'-(3-(3-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду

а) Одержання 4-метил-2-нітро-6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)аніліну

Перемішувану суміш 2-бром-4-метил-6-нітроаніліну (2,00 г, 8,7 ммоль), біс(пінакол)дибору (4,4 г, 17,3 ммоль), [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) дихлорметану [PdCl₂(dppf)-CH₂Cl₂] (0,35 г, 0,4 ммоль) та ацетату калію (2,1 г, 21,6 ммоль) в 1,4-діоксані (30 мл) дегазували азотом. Реакційну суміш перемішували при 95 °С протягом 16 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли дихлорметаном, фільтрували через шар целіту, залишок промивали дихлорметаном (100 мл). Об'єднаний фільтрат промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та розчинник видаляли за зниженого тиску.

Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані з одержанням 4-метил-2-нітро-6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)аніліну (2 г, 7,3 ммоль, вихід 85 %) у вигляді жовтої твердої речовини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,97 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,30 (s, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,33 (s, 12H); GCMS: 278,2.

б) Одержання 2-(3-фторбензил)-4-метил-6-нітроаніліну

Суміш 4-метил-2-нітро-6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)аніліну (2,0 г, 7,2 ммоль), 1-(бромметил)-3-фторбензолу (1,4 г, 7,2 ммоль), тетракіс(трифенілфосфін)паладію(0) [Pd(Ph₃P)₄] (0,42 г, 0,4 ммоль) та карбонату калію (2,5 г, 17,9 ммоль) у суміші діоксан:вода (35 мл, 8:2) дегазували азотом. Реакційну суміш перемішували при 100 °С протягом 4 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту. Фільтрат розбавляли етилацетатом (200 мл) та промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та розчинник видаляли за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 2-(3-фторбензил)-4-метил-6-нітроаніліну (1,4 г, 5,2 ммоль, вихід 73 %) у вигляді жовтої твердої речовини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,74 (d, 1H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,14 (d, 1H), 7,09-7,00 (m, 3H), 3,98 (s, 2H), 2,16 (s, 3H); GCMS: 260,1.

с) Одержання 2-бром-1-(3-фторбензил)-5-метил-3-нітробензолу

До перемішуваної суміші 2-(3-фторбензил)-4-метил-6-нітроаніліну (2,0 г, 8,3 ммоль), броміду міді(І) (2,2 г, 15,4 ммоль) в ацетонітрилі (20 мл) по краплях при 0 °С додавали трет-бутилнітрит (2,4 г, 23,0 ммоль). Після завершення додавання забезпечували перемішування реакційної суміші при 25 °С протягом 1 год. Після завершення реакції реакційну суміш фільтрували через шар целіту, промивали ацетонітрилом. Фільтрат концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт розчиняли в етилацетаті (50 мл), промивали водним розчином хлориду амонію, сольовим розчином та висушували над безводним сульфатом натрію. Розчинник видаляли за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 2-бром-1-(3-фторбензил)-5-метил-3-нітробензолу (1,8 г, 5,5 ммоль, вихід 71 %) у вигляді жовтої твердої речовини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,68 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,37-7,31 (m, 1H), 7,07-7,01 (m, 3H), 4,17 (s, 2H), 2,32 (s, 3H); GCMS: 324,9.

д) Одержання 3-(3-фторбензил)-2,5-диметиланіліну

Суміш 2-бром-1-(3-фторбензил)-5-метил-3-нітробензолу (2,0 г, 6,2 ммоль), метилборонової кислоти (0,7 г, 12,3 ммоль), аддукту PdCl₂(dppf)-CH₂Cl₂ (0,5 г, 0,6 ммоль) та трьохосновного фосфату калію (3,3 г, 15,4 ммоль) у суміші діоксан:вода (35 мл, 8:2) дегазували азотом. Реакційну суміш перемішували при 100 °С протягом 4 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту. Фільтрат розбавляли етилацетатом (200 мл) та промивали сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію та розчинник видаляли за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 1-(3-фторбензил)-2,5-диметил-3-нітробензолу (1,4 г, 5,5 ммоль, вихід 89 %) у вигляді жовтої твердої речовини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,55 (s, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,05-7,00 (m, 1H), 6,96 (d, 2H), 4,08 (s, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,18 (s, 3H); GCMS: 259,1.

е) Одержання 3-(3-фторбензил)-2,5-диметиланіліну

До перемішуваного розчину 1-(3-фторбензил)-2,5-диметил-3-нітробензолу (1 г, 3,8 ммоль) у водному розчині етанолу (15 мл, 2:1) додавали залізний порошок (1,0 г, 19,2 ммоль) та хлорид амонію (1,4 г, 27,0 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °С протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту та ретельно промивали етилацетатом. Об'єднаний фільтрат випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт розбавляли насиченим водним розчином бікарбонату натрію та тричі екстрагували етилацетатом (50 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою, сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та випарювали за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 3-(3-фторбензил)-2,5-диметиланіліну (0,8 г, 3,4 ммоль, вихід 89 %) у вигляді коричневої рідини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,32-7,27 (m, 1H), 7,00-6,95 (m, 2H), 6,88 (d, 1H), 6,38 (s, 1H), 6,26 (s, 1H), 4,69 (s, 2H), 3,86 (s, 2H), 2,12 (s, 3H), 1,85 (s, 3H); GCMS: 229,1.

ф) Одержання N-етил-N'-(3-(3-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду

До перемішуваного розчину 3-(3-фторбензил)-2,5-диметиланіліну (1,0 г, 4,3 ммоль) в 1,4-діоксані (10 мл) додавали безводний моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,04 г, 0,2 ммоль) та N-(диметоксиметил)-N-метилетанамін (0,6 г, 4,3 ммоль) та одержану суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °С протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N-етил-N'-(3-(3-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідаміду (0,9 г, 3,1 ммоль, вихід 70 %) у вигляді коричневої рідини. ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,57 (brs, 1H), 7,33-7,27 (m, 1H), 7,01-6,95 (m, 2H), 6,91-6,87 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15.

Приклад 4. Одержання N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідаміду

а) Одержання 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну

До перемішуваного розчину 1-бром-5-фтор-2-метил-3-нітробензолу (10 г, 42,7 ммоль) у водному розчині етанолу (130 мл, 2:1) додавали залізний порошок (23,9 г, 427 ммоль) та хлорид амонію (22,9 г, 427 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °С протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту та ретельно промивали етилацетатом (250 мл). Об'єднаний фільтрат випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт розбавляли насиченим водним розчином бікарбонату натрію та тричі екстрагували етилацетатом (150 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою, сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та випарювали за зниженого тиску з

одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 5 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням необхідного 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну (8 г, 39,0 ммоль, вихід 91 %); GCMS: 202,9.

б) Одержання N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До перемішаного розчину 3-бром-5-фтор-2-метиланіліну (8 г, 39,2 ммоль) у триметилортоформіаті (50 мл) додавали безводний моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,75 г, 3,9 ммоль) та одержану суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °С протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт розчиняли в 1,4-діоксані (50 мл) в атмосфері азоту з наступним додаванням N-етилметиламіну (10,1 мл, 12 ммоль). Одержану реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 80 °С протягом 3 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (8 г, 29,3 ммоль, вихід 75 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,75-7,64 (m, 1H), 7,00 (dd, 1H), 6,77-6,71 (m, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,01-2,92 (m, 3H), 2,25 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1) 272,7.

с) Одержання N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідаміду

Перемішувану суспензію N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,7 г, 2,5 ммоль), піридин-2-аміну (0,3 г, 3,1 ммоль), карбонату цезію (2,1 г, 6,4 ммоль) у безводному толуолі (10 мл) дегазували азотом протягом 15 хв. Додавали ацетат паладію (0,03 г, 0,1 ммоль) та 2,2'-біс(дифенілфосфіно)-1,1'-бінафтил (BINAP) (0,16 г, 0,3 ммоль) і реакційну суміш нагрівали при 100 °С протягом 16 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш пропускали через целіт, ретельно промивали етилацетатом (25 мл). Об'єднані органічні шари двічі промивали водою (50 мл), один раз сольовим розчином (50 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували за зниженого тиску. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 40 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідаміду (0,3 г, 1 ммоль, вихід 38 %); LCMS: 286,95.

д) Одержання N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідаміду

До суспензії гідриду натрію (0,06 г, 1,4 ммоль) в N,N-диметилформаміді (5 мл) по краплях при 0-5 °С додавали розчин N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідаміду (0,2 г, 0,7 ммоль) в N,N-диметилформаміді (3 мл) та забезпечували перемішування реакційної суміші протягом 15 хв. Після цього по краплях додавали метилйодид (0,12 г, 1,4 ммоль) та перемішування продовжували протягом 45 хв. Після завершення реакції суміш гасили в льодяній воді, двічі екстрагували етилацетатом (50 мл). Органічний шар двічі промивали водою (50 мл), далі сольовим розчином (50 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N-етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідаміду (0,16 г, 0,5 ммоль, вихід 74 %); LCMS: 301,4.

Приклад 5. Синтез N'-(2-хлор-5-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

а) Одержання 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу

До розчину 2-бром-4-метил-6-нітроаніліну (15 г, 64,9 ммоль) в ацетонітрилі (150 мл) додавали хлорид міді(I) (9,6 г, 97 ммоль) та реакційну суміш перемішували при 25 °С протягом 30 хв. Потім по краплях при 0 °С додавали трет-бутилнітрит (38,5 мл, 325 ммоль) та реакційну суміш повільно доводили до 25 °С із продовженням перемішування протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш гасили водним розчином хлориду амонію та тричі екстрагували етилацетатом (200 мл). Об'єднані органічні шари промивали сольовим розчином (200 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували за зниженого тиску. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу (12 г, 48 ммоль, вихід 74 %); GCMS: 251,0.

б) Одержання 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну

До перемішаного розчину 1-бром-2-хлор-5-метил-3-нітробензолу (13 г, 51,9 ммоль) у водному розчині етанолу (130 мл, 2:1) додавали залізний порошок (29 г, 519 ммоль) та хлорид амонію (27,8 г, 519 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80 °С протягом 2 год. Після завершення реакції реакційну суміш охолоджували до 25 °С, фільтрували через шар целіту та ретельно промивали етилацетатом. Об'єднаний фільтрат випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт розбавляли насиченим водним розчином бікарбонату натрію та тричі екстрагували етилацетатом (250 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою, сольовим розчином, висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та випарювали за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту, який очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну (9,1 г, 41 ммоль, вихід 79 %); GCMS: 220,9.

с) Одержання N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До перемішаного розчину 3-бром-2-хлор-5-метиланіліну (8,5 г, 38,5 ммоль) у триметилортоформіаті (50 мл) додавали безводний моногідрат п-толуолсульфонової кислоти (0,7 г, 3,8 ммоль) та одержану суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 105 °С протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт розчиняли в 1,4-діоксані (50 мл) в атмосфері азоту з наступним додаванням N-етилметиламіну (10,1 мл, 118 ммоль). Одержану реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при 80 °С протягом 3 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 7 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (8,9 г, 31,4 ммоль, вихід 82 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,74-7,63 (m, 1H), 7,12 (q, 1H), 6,80 (d, 1H), 3,47-3,30 (m, 4H), 3,03-2,94 (m, 3H), 2,22 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1) 291,0.

д) Одержання N'-(2-хлор-5-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

Суміш N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,7 г, 2,41 ммоль), піридин-2-аміну (0,3 г, 3,1 ммоль), карбонату цезію (2 г, 6,0 ммоль) у безводному толуолі (10 мл) дегазували азотом. Після цього додавали ацетат паладію (0,03 г, 0,1 ммоль) та 2,2'-біс(дифенілфосфіно)-1,1'-бінафтил (BINAP) (0,15 г, 0,2 ммоль) та реакційну суміш нагрівали при 100 °С протягом 16 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш пропускали через целіт та промивали етилацетатом (50 мл). Об'єднані органічні шари двічі промивали водою (50 мл), сольовим розчином (50 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували за зниженого тиску. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 40 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(2-хлор-5-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,5 г, 40,8 ммоль, вихід 72 %); LCMS: 303,4.

е) Одержання N'-(2-хлор-5-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До суспензії гідриду натрію (0,1 г, 1,7 ммоль) в N,N-диметилформаміді (5 мл) по краплях при 0-5 °С додавали розчин N'-(2-хлор-5-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,3 г, 1,1 ммоль) в N,N-диметилформаміді (3 мл). Після перемішування протягом 15 хв. до реакційної суміші додавали метилйодид (0,2 г, 1,4 ммоль) та перемішування продовжували протягом ще 1 год. Після завершення реакції реакційну суміш гасили в льодяній воді, двічі екстрагували етилацетатом (50 мл). Органічний шар двічі промивали водою (25 мл), сольовим розчином (50 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували за зниженого тиску. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(2-хлор-5-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,22 г, 0,7 ммоль, вихід 62 %); LCMS: 317,40.

Приклад 6. Одержання N'-(3-(2-(2-хлор-4-метоксифенокс)ацетил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

а) Одержання 2-хлор-N-метокси-N-метилацетаміду

До перемішаного розчину N,O-диметилгідроксиламіну гідрохлориду (25 г, 256 ммоль) у діетиловому етері (50 мл) та воді (50 мл) додавали карбонат калію (78 г, 564 ммоль) із наступним додаванням 2-хлорацетилхлориду (24,50 мл, 308 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 25 °С протягом 16 год. Після завершення реакції реакційну суміш гасили за допомогою додавання води, суміш двічі екстрагували 1,2-дихлорметаном (250 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою (100 мл), сольовим розчином (100 мл), висушували над сульфатом натрію та випарювали за зниженого тиску з одержанням 2-хлор-N-метокси-N-метилацетаміду (25 г, 182 ммоль, вихід 71 %).

б) Одержання 2-(2-хлор-4-метоксифенокс)-N-метокси-N-метилацетаміду

До перемішаного розчину 2-хлор-4-метоксифенолу (2,77 г, 17,45 ммоль) в N,N-диметилформаміді (15 мл) додавали карбонат калію (4,02 г, 29,1 ммоль) із наступним додаванням 2-хлор-N-метокси-N-метилацетаміду (2 г, 14,54 ммоль) та реакційну суміш перемішували при 25 °С протягом 16 год. Після завершення реакції реакційну суміш гасили льодяною водою та тричі екстрагували етилацетатом (150 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою, сольовим розчином, висушували над сульфатом натрію та розчинник випарювали за зниженого тиску з одержанням 2-(2-хлор-4-метоксифенокс)-N-метокси-N-метилацетаміду (2,9 г, 11,17 ммоль, вихід 77 %).

с) Одержання N'-(3-(2-(2-хлор-4-метоксифенокс)ацетил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

До перемішаного розчину N'-(3-бром-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,7 г, 2,56 ммоль) у тетрагідрофурані (10 мл) додавали н-бутиллітій (2,56 мл, 5,13 ммоль) при -78 °С. Реакційну суміш перемішували при -78 °С протягом 1 год. та потім додавали 2-(2-хлор-4-метоксифенокс)-N-метокси-N-метилацетамід (0,799 г, 3,08 ммоль) та забезпечували перемішування реакційної суміші протягом 1 год. при -78 °С. Після завершення реакції реакційну суміш гасили водним розчином хлориду амонію та тричі екстрагували етилацетатом (75 мл). Об'єднані органічні шари промивали водою (50 мл), сольовим розчином та висушували над безводним сульфатом натрію; розчинник випарювали за зниженого тиску. Неочищений продукт додатково очищали шляхом препаративної вискоєфективної рідинної хроматографії з одержанням N'-(3-(2-(2-хлор-4-метоксифенокс)ацетил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,116 г, 0,295 ммоль, вихід 11 %).

Приклад 7. Одержання N'-(2-хлор-5-метил-3-((2-(трифторметил)бензил)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду

Перемішвану суспензію N'-(3-бром-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,7 г, 2,417 ммоль), (2-(трифторметил)феніл)метанаміну (0,441 мл, 3,14 ммоль) та карбонату цезію (1,969 г, 6,04 ммоль) у безводному толуолі (10 мл) дегазували азотом протягом 15 хв. До цієї реакційної суміші додавали ацетат паладію (0,027 г, 0,121 ммоль) та 2,2'-біс(дифенілфосфіно)-1,1'-бінафтил (BINAP) (0,151 г, 0,242 ммоль) та реакційну суміш нагрівали при 100 °С протягом 16 год. в атмосфері азоту. Після завершення реакції реакційну суміш пропускали через целіт, ретельно промивали етилацетатом (25 мл). Об'єднані органічні шари двічі промивали водою (50 мл), один раз сольовим розчином (50 мл), висушували над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували за зниженого тиску. Одержаний неочищений продукт очищували за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 40 % етилацетату в гексані як елюенту з одержанням N'-(2-хлор-5-метил-3-((2-(трифторметил)бензил)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідаміду (0,16 г, 0,417 ммоль, вихід 17 %).

Наступні сполуки у таблиці I одержували із застосуванням аналогічних процедур, як описано на схемах 1-21 або в прикладах.

Таблиця I

Серійний номер	Назва за IUPAC	Аналітичні дані
1	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(п-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,68 (s, 1H), 7,12 (s, 1H), 6,99-

		6,96 (m, 3H), 6,81 (s, 1H), 6,67 (d, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,20
2	N'-(2,5-Диметил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,53 (brs, 1H), 7,05 (d, 2H), 6,97 (d, 2H), 6,55 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,35-3,28 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,40
3	N'-(3-(3-Хлорбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,56 (brs, 1H), 7,35-7,26 (m, 1H), 7,22-7,20 (m, 1H), 7,11 (s, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,59 (s, 1H), 6,48 (s, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,15
4	N'-(2,5-Диметил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,60 (s, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,12-7,05 (m, 2H), 6,80-6,78 (m, 1H), 6,48 (s, 1H), 6,35 (s, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,65
5	N-Етил-N'-(3-(3-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,57 (brs, 1H), 7,33-7,27 (m, 1H), 7,01-6,95 (m, 2H), 6,91-6,87 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15
6	N-Етил-N'-(3-((2-фторфеніл)аміно)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,74-7,41 (m, 1H), 7,14-7,09 (m, 1H), 7,03 (s, 1H), 6,97-6,93 (m, 1H), 6,76-6,71 (m, 1H), 6,67-6,63 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 6,37 (s, 1H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,40
7	N-Етил-N'-(3-((2-фторфеніл)(метил)аміно)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,63 (m, 1H), 7,16-7,01 (m, 2H), 6,89-6,82 (m, 2H), 6,44 (s, 2H), 3,59-3,32 (m, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,15-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 315,15
8	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(феніламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,72 (s, 1H), 7,41 (s, 1H), 7,23-7,18 (m, 2H), 6,93 (dd, 2H), 6,81-6,77 (m, 1H), 6,50 (dd, 1H), 6,32 (d, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 285,85
9	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(феніламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,73 (s, 1H), 7,39 (s, 1H), 7,22 (dd, 2H), 7,05-7,03 (m, 2H), 6,84 (t, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,38 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 302,05

10	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,75 (s, 1H), 7,18-7,10 (m, 2H), 6,76-6,71 (m, 2H), 6,65 (t, 1H), 6,50 (dd, 2H), 3,45-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,00
11	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,78 (s, 1H), 7,16-7,12 (m, 2H), 6,68-6,64 (m, 2H), 6,56-6,49 (m, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,93 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,05
12	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,71 (bs, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,15-7,08 (m, 2H), 6,90-6,87 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,96 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 314,85
13	N'-(2-Хлор-3-(2-хлорбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,71 (bs, 1H), 7,49-7,45 (m, 1H), 7,30-7,24 (m, 2H), 7,03-7,01 (m, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 4,09 (s, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 335,05
14	N'-(2-Хлор-3-(2-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,69 (bs, 1H), 7,30-7,24 (m, 1H), 7,20-7,06 (m, 3H), 6,69 (s, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,45
15	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(о-толіламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,71 (s, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,13-7,08 (m, 1H), 6,94-6,90 (m, 1H), 6,83-6,80 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,23 (d, 1H), 5,99-5,95 (m, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 300,45
16	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((4-(трифторметил)тіо)феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,12 (s, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,47-7,44 (m, 2H), 6,87-6,84 (m, 2H), 6,59 (dd, 1H), 6,52 (d, 1H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,45
17	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,67 (s, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,00-6,96 (m, 3H), 6,69-6,65 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,40
18	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,66 (bs, 1H), 7,12-7,04 (m, 4H), 6,68-6,67 (m, 1H), 6,66-6,61 (m, 1H), 3,95 (m, 2H), 3,45-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 315,45

19	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((2-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (s, 1H), 7,21-7,15 (m, 2H), 7,05-7,02 (m, 1H), 6,92-6,86 (m, 2H), 6,36 (d, 1H), 6,24 (dd, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 304,45
20	N'-(3-((4-(трет-Бутил)феніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,25-7,22 (m, 3H), 6,92-6,89 (m, 2H), 6,45 (dd, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,26 (s, 9H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 342,65
21	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,61 (m, 2H), 7,57 (t, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,04 (d, 1H), 6,73 (s, 1H), 6,50-6,49 (m, 1H), 4,19 (s, 2H), 3,45-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,50
22	N'-(2-Хлор-3-(3-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (bs, 1H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,04-6,96 (m, 3H), 6,74-6,73 (m, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,55
23	N'-(2-Хлор-3-((2-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 7,24-7,19 (m, 1H), 7,13-7,09 (m, 3H), 7,01-6,97 (m, 1H), 6,37 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 320,20
24	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(o-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,16 (t, 1H), 7,06-6,98 (m, 2H), 6,69 (s, 1H), 6,25 (s, 1H), 6,12 (d, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,17-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,15
25	N'-(3-((4-(трет-Бутил)феніл)аміно)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,26 (d, 2H), 7,19 (s, 1H), 7,04-7,01 (m, 2H), 6,65 (d, 1H), 6,30 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,27 (s, 9H), 1,17-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 359,95
26	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((4-(трифторметил)тіо)феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,14 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,48-7,45 (m, 2H), 6,97-6,94 (m, 2H), 6,79 (d, 1H), 6,57 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 402,2
27	N'-(2-Хлор-3-(3-хлорбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (bs, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,24-7,21 (m, 1H), 7,19 (s, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,74-6,73 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,18-2,23 (m, 3H), 1,13-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,05
28	N'-(2-Хлор-3-(3-метоксибензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,62 (bs, 1H), 7,21-7,17 (m, 1H), 6,77-6,74 (m, 3H), 6,70 (d,

		1H), 6,65 (s, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,15
29	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 2H), 7,17 (q, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,48-6,57 (m, 3H), 6,41 (d, 1H), 3,39 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,22-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 303,8
30	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,09 (t, 1H), 6,54-6,46 (m, 3H), 6,38-6,33 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,45-3,332 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,15
31	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(м-толіламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 2H), 7,17 (q, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,57-6,48 (m, 3H), 6,41 (d, 1H), 3,39 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,22-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 300,2
32	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фторфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,16-7,10 (m, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,41 (m, 1H), 6,27-6,23 (m, 2H), 3,46-3,36 (m, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,15
33	N'-(3-((3-Хлорфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 2H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 2H), 3,41 (dd, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,98 (t, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,15
34	N'-(2-Хлор-3-((3-хлорфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 2H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 3H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,98 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,70
35	N'-(2-Хлор-3-((3-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73-7,59 (m, 2H), 7,18 (q, 1H), 6,77 (dd, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,68 (dt, 1H), 6,54 (td, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 320,2
36	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(м-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (s, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,14-7,08 (m, 1H), 6,90-6,81 (m, 2H), 6,67-6,65 (m, 2H), 6,36 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,25 (d, 3H), 2,17-2,15 (m, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,15
37	N'-(3-((3-Хлорфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 2H), 7,18 (t, 1H), 6,81-6,74 (m, 3H), 6,54 (dd, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1):

		320,40
38	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(м-толіл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 6,66 (d, 1H), 6,53-6,48 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 3,44-3,35 (m, 1H), 3,12 (s, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 314,20
39	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-метоксифеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,14 (t, 1H), 6,73-6,66 (m, 2H), 6,58 (dd, 1H), 6,46-6,39 (m, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 3,15 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,98 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,20-1,14 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,25
40	N'-(2-Хлор-3-((3-фторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,77 (s, 1H), 7,09-7,13 (m, 1H), 6,74-6,80 (m, 1H), 6,41-6,45 (m, 1H), 6,22-6,27 (m, 2H), 3,33 (d, 3H), 3,19 (m, 3H), 3,15 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 1,14-1,23 (m, 3H); LCMS (M+1): 334,15
41	N'-(2-Хлор-3-((3-хлорфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,13 (t, 1H), 6,81-6,74 (m, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,69-6,46 (m, 1H), 6,44-6,41 (m, 2H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,16 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,15
42	N'-(2-Хлор-3-((3-метоксифеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,09 (t, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,60 (dd, 2H), 6,41-6,36 (m, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,38 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,20
43	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(м-толіл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,00 (t, 1H), 6,75-6,69 (m, 1H), 6,48 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,35-3,30 (m, 2H), 3,14 (d, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,25
44	N'-(2-Хлор-3-(4-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,23-7,19 (m, 2H), 7,12-7,06 (m, 2H), 6,71-6,70 (m, 1H), 6,61 (s, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,15
45	N'-(3-(2-Бромбензил)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72-7,60 (m, 2H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,21-7,16 (m, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,48 (s, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,00
46	N'-(2-Хлор-3-(4-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,73 (m, 2H), 7,69 (brs, 1H), 7,37 (d, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,10 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 3H), 2,91 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,15
47	N'-(2-Хлор-3-(2-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ

	метилформімідамід	7,83-7,81 (m, 1H), 7,70-7,58 (m, 2H), 7,41 (t, 1H), 7,16 (d, 1H), 6,72 (s, 1H), 6,61 (s, 1H), 4,20 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,15
48	N'-(2-Хлор-3-(3-ціанобензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,55-7,48 (m, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,15
49	N'-(2-Хлор-3-((3-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76 (s, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,73 (d, 2H), 6,27 (d, 1H), 6,07-6,03 (m, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,44-3,41 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,17-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 346,80
50	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,40-7,34 (m, 2H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,11-7,08 (m, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,59 (s, 1H), 4,05 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 385,35
51	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,39 (d, 2H), 6,77 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,11 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,35
52	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(4-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,31-7,26 (m, 4H), 6,76 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,35
53	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,47 (m, 5H), 6,78 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,12 (s, 2H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,15
54	N'-(2-Хлор-3-(3-хлор-4-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,37-7,30 (m, 2H), 7,20-7,16 (m, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,92 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,15
55	N'-(2-Хлор-3-(3,5-диметилбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 6,80 (d, 3H), 6,68 (d, 1H), 6,64 (s, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,21 (s, 6H), 2,19 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,40
56	N'-(2-Хлор-3-(3-хлор-2-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,69 (s, 1H), 6,64 (s, 1H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 1H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 355,10
57	N'-(2-Хлор-3-(5-фтор-2-метилбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,05-7,02 (m,

		1H), 6,95-6,86 (m, 2H), 6,66 (s, 1H), 6,39 (d, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,41-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,15
58	N'-(2-Хлор-3-((3-ізопропілфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 7,57 7,25 (s, 1H), 7,13-7,09 (t, 1H), 6,97 (t, 1H), 6,85-6,83 (d, 1H), 6,73-6,71 (d, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,34 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,84-2,77 (m, 1H), 2,16 (s, 3H), 1,20-1,13 (m, 9H); LCMS (M+1): 344,25
59	N'-(2-Хлор-3-((4-хлорфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73-7,60 (m, 2H), 7,25-7,21 (m, 2H), 7,01-6,97 (m, 2H), 6,69-6,68 (m, 1H), 6,42 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,20 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 336,15
60	N'-(2-Хлор-3-((4-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 7,34 (s, 1H), 7,11-7,06 (m, 4H), 6,57 (d, 1H), 6,33 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (m+1): 320,15
61	N'-(2-Хлор-3-((4-метоксифеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (s, 1H), 7,08-7,05 (m, 2H), 7,01 (s, 1H), 6,90-6,87 (m, 2H), 6,41 (d, 1H), 6,21 (s, 1H), 3,74 (d, 3H), 3,44-3,32 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,08
62	N'-(2-Хлор-3-((4-хлорфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,18-7,14 (m, 2H), 6,78-6,73 (m, 2H), 6,50-6,46 (m, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 3,16 (d, 3H), 2,97 (t, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 350,15
63	N'-(2-Хлор-3-((3-ізопропілфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76 (d, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,74-6,70 (m, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,24 (dd, 1H), 3,36 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,97 (m, 3H), 2,75 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,16 (d, 9H); LCMS (M+1): 358,10
64	N'-(2-Хлор-3-((4-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 6,76 (d, 2H), 6,69-6,65 (m, 2H), 6,51-6,48 (m, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,32 (m, 2H), 3,12 (d, 3H), 2,97 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,14 (d, 3H); LCMS (M+1): 346,3
65	N'-(2-Хлор-3-(4-фтор-2-метилбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,07-7,03 (m, 1H), 6,93-6,87 (m, 2H), 6,68 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,245 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,20
66	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(піридин-3-ілметил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,48-8,39 (m, 2H), 7,68-7,54 (m, 2H), 7,31-7,28 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,17-1,08 (m, 3H);

		LCMS (M+1): 302,15
67	N'-(2-Хлор-3-(3,4-дифторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,36-7,29 (m, 1H), 7,24-7,18 (m, 1H), 7,03-6,99 (m, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,20
68	N'-(2-Хлор-3-(4-фтор-3-метилбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,10-7,08 (m, 1H), 7,05-7,00 (m, 2H), 6,70 (d, 1H), 6,66 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,25
69	N'-(2-Хлор-3-((4-фторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,00-6,95 (m, 2H), 6,73 (d, 2H), 6,51-6,47 (m, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,93 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,24-1,14 (m, 3H)
70	N'-(3-Бензил-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (brs, 1H), 7,30-7,26 (m, 2H), 7,20-7,16 (m, 3H), 6,71 (s, 1H), 6,66 (s, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,52-3,36 (s, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 301,05
71	N'-(2-Хлор-3-(3,5-дифтор-4-метоксибензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,96-6,89 (m, 2H), 6,76 (d, 1H), 6,70 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,95
72	N'-(2-Хлор-3-((3,4-дифторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (s, 1H), 7,32-7,26 (m, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,08-7,01 (m, 2H), 6,31 (s, 1H), 6,16 (s, 1H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 338,05
73	N'-(3-((3,4-Дифторфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74-7,62 (m, 2H), 7,27-7,19 (m, 1H), 6,86-6,77 (m, 1H), 6,68-6,64 (m, 1H), 6,52-6,48 (m, 1H), 6,40 (d, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 322
74	N'-(2-Хлор-3-((3,5-дифторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,84-6,77 (m, 2H), 6,39 (t, 1H), 6,07-6,05 (m, 2H), 3,48-3,30 (m, 2H), 3,18 (d, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,18-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,4
75	N'-(2-Хлор-3-((2,4-дифторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72-7,61 (m, 2H), 7,29-7,21 (m, 1H), 6,96-6,93 (m, 1H), 6,81-6,77 (m, 1H), 6,69-6,67 (m, 1H), 6,44 (s, 1H), 3,48-3,32 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,14 (s, 3H); LCMS (M+1): 338,05
76	N'-(3-((2,4-Дифторфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,29-7,23 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 7,01-6,96 (m, 2H), 6,29 (d, 1H), 6,08-6,05 (m, 1H),

		3,44-3,30 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,15
77	N'-(3-((3,5-Дифторфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,07 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 6,59 (dd, 1H), 6,52 (d, 1H), 6,46-6,41 (m, 1H), 6,39-6,34 (m, 2H), 3,45 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,05
78	N'-(2-Хлор-3-((3,5-дифторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,10 (d, 1H), 7,75-7,62 (m, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,58 (s, 1H), 6,50-6,45 (m, 3H), 3,47-3,33 (m, 2H), 3,01-2,93 (m, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,17-1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,95
79	N'-(3-Бензил-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,31-7,27 (m, 2H), 7,21-7,17 (m, 1H), 7,15-7,13 (m, 2H), 6,76 (s, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,41-3,38 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,00
80	N'-(3-((2,4-Дифторфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,21-7,15 (m, 1H), 7,01-6,88 (m, 2H), 6,52-6,44 (m, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,89 (s, 3H), 1,15-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,2
81	N'-(2-Хлор-3-((3,4-дифторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76 (d, 1H), 7,20-7,13 (m, 1H), 6,80-6,74 (m, 2H), 6,49-6,43 (m, 1H), 6,21-6,16 (m, 1H), 3,48-3,33 (m, 2H), 3,14 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,18-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,45
82	N'-(2-Хлор-3-((2,4-дифторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,62 (d, 1H), 7,15-7,09 (m, 1H), 6,98-6,90 (m, 2H), 6,56 (s, 2H), 3,39-3,33 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,14-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,0
83	N'-(3-((3,4-Дифторфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (d, 1H), 7,16-7,08 (m, 1H), 6,66 (d, 1H), 6,53 (d, 1H), 6,44-6,41 (m, 1H), 6,13 (t, 1H), 3,43-3,31 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 1,87 (s, 3H), 1,12-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,0
84	N'-(3-((3,5-Дифторфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,72 (t, 1H), 6,59 (dd, 1H), 6,37 (t, 1H), 6,04 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,16 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,15-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 336,45
85	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,09 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,89 (d, 1H), 6,72 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,4
86	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((3-метилпіридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,00 (dd, 1H), 7,72-7,61 (m,

		1H), 7,48-7,46 (m, 1H), 7,20 (s, 1H), 6,74 (dd, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,96 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,45
87	N'-(5-Хлор-3-(4-фтор-3,5-диметилбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,70 (brs, 1H), 6,83 (d, 2H), 6,75 (d, 2H), 3,83 (s, 2H), 3,49-3,34 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,50
88	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,73 (brs, 1H), 7,22-7,19 (m, 1H), 7,16-7,09 (m, 2H), 6,86-6,84 (m, 1H), 6,77 (s, 1H), 6,44 (d, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,20
89	N'-(5-Хлор-3-(2-хлорбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,73 (BRS, 1H), 7,51-7,47 (m, 1H), 7,31-7,25 (m, 2H), 7,04-7,00 (m, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,54 (d, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,93 (S, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15-1,11 (M, 3H); LCMS (M+1): 335,15
90	N'-(3-(2-Бромбензил)-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,74-7,63 (m, 2H), 7,33 (t, 1H), 7,21 (t, 1H), 7,01 (d, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,52 (d, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,93 (S, 3H), 2,10 (S, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,05
91	N'-(2-Хлор-3-(2,6-дифторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,70 (brs, 1H), 7,43-7,37 (m, 1H), 7,16-7,10 (m, 2H), 6,66 (s, 1H), 6,32 (s, 1H), 4,02 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,00
92	N'-(2-Хлор-3-(2-хлор-6-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,71 (brs, 1H), 7,46-7,39 (m, 2H), 7,32-7,27 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,04 (s, 1H), 4,12 (s, 2H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,90
93	N'-(3-(4-Бромбензил)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,68 (brs, 1H), 7,48-7,45 (m, 2H), 7,14 (d, 2H), 6,73-6,68 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 380,85
94	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,71 (brs, 1H), 7,19-7,15 (m, 1H), 7,01 (d, 1H), 6,95 (d, 1H), 6,92 (s, 1H), 6,75 (d, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,27 (sz, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 316,90
95	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піридин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,10-8,07 (m, 2H), 7,68 (d, 1H), 7,55-7,50 (m, 1H), 7,19-7,14 (m,

		1H), 6,82-6,79 (m, 1H), 6,72-6,68 (m, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,56-3,31 (m, 2H), 2,97 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 286,95
96	N'-(3-((3-Хлор-5-фторфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,06 (s, 1H), 7,69 (d, 1H), 6,62 (dt, 1H), 6,56 (dd, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,45 (dt, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,95
97	N'-(2-Хлор-3-((3-хлор-5-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,10 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,68-6,63 (m, 2H), 6,57-6,52 (m, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,35
98	N'-(3-((5-Хлор-2-метилфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,78-7,59 (m, 1H), 7,15 (dd, 1H), 7,02-6,99 (m, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,54-6,44 (m, 1H), 6,23-6,19 (m, 1H), 3,33 (d, 2H), 3,01-2,92 (m, 6H), 1,98 (d, 3H), 1,89-1,85 (m, 3H), 1,13 (d, 3H); LCMS (M+1): 348,45
99	N'-(2-Хлор-3-((3-хлор-5-фторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 6,79-6,77 (m, 2H), 6,60 (dt, 1H), 6,23 (t, 2H), 3,48-3,23 (m, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,15
100	N'-(2-Хлор-3-((5-хлор-2-метилфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (m, , 1H), 7,18 (dd, 1H), 6,96-6,89 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 6,43-6,31 (m, 1H), 3,45-3,33 (m, 3H), 2,97 (d, 1H), 2,52-2,50 (m, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,21-2,08 (m, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,20
101	N'-(5-Хлор-3-(3-хлорбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,11 (d, 1H), 6,81-6,79 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,48-3,34 (m, 2H), 2,92 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (s, 3H); LCMS (M+1): 336,95
102	N'-(5-Хлор-3-(3-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,36-7,31 (m, 1H), 7,05-6,93 (m, 3H), 6,80-6,78 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,35
103	N'-(5-Хлор-3-(2-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,29-7,24 (m, 1H), 7,20-7,15 (m, 1H), 7,13-7,09 (mz, 1H), 7,04 (td, 1H), 6,76 (s, 1H), 6,65 (d, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,40-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,45
104	N'-(5-Хлор-3-(2-ціанобензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,84 (dd, 1H), 7,72-7,60 (m, 2H), 7,43 (td, 1H), 7,15 (d, 1H), 6,81-6,78 (m, 1H), 6,60 (d, 1H), 4,13 (s, 2H), 3,42-3,32 (s, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12

		(t, 3H); LCMS (M+1): 326,50
105	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (brs, 1H), 7,07 (d, 2H), 6,99 (d, 2H), 6,72-6,71 (m, 2H), 3,85 (s, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 321,50
106	N'-(3-((3-Хлор-5-фторфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 6,73 (t, 1H), 6,61-6,56 (m, 2H), 6,20 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,96 (s, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,16-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 352,45
107	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,11 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,36-7,40 (m, 1H), 6,80 (d, 2H), 6,62-6,59 (m, 1H), 6,10 (d, 1H), 3,28-3,46 (m, 2H), 2,98 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,16 (t, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,4
108	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(3-метилпіридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,39-3,31 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,11-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,45
109	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,14-8,12 (m, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,41-7,36 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,65-6,59 (m, 2H), 6,08 (d, 1H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 300,38
110	N'-(2-Хлор-3-((5-хлор-2-метилфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,52 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,39-3,31 (m, 2H), 3,02 (d, 3H), 2,92 (d, 3H), 2,11 (d, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,05-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 364,3
111	N'-(2-Хлор-3-((3-фтор-5-метилфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61-7,72 (m, 2H), 6,73 (d, 1H), 6,60 (s, 1H), 6,49 (d, 2H), 6,40 (d, 1H), 3,46 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,21 (d, 6H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
112	N'-(2-Хлор-3-((5-хлор-3-метилпіридин-2-іл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,98 (t, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,62-7,58 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,38-7,36 (m, 1H), 6,54 (s, 1H), 3,35-3,45 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,26 (d, 6H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 351,27
113	N'-(3-((2-Хлор-5-метилфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,69-6,66 (m, 1H), 6,54 (d, 1H), 6,46 (d, 1H), 6,36 (dd, 1H), 3,47-3,30 (m, 5H), 2,97 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
114	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фтор-5-метилфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (d, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,53 (d, 1H), 6,43 (d, 1H), 6,38 (s, 1H), 6,35 (d, 1H), 3,47-3,33 (m, 2H), 3,01-2,93-(m, 3H), 2,19 (s,

		3H), 2,05 (d, 3H), 1,15-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,38
115	N'-(2-Хлор-3-((2-хлор-5-метилфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,88-6,84 (m, 2H), 6,76 (dd, 1H), 6,54 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,28
116	N'-(3-((5-Хлор-2-метилфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76 (s, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,82 (dd, 1H), 6,51 (d, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,23 (dd, 1H), 3,47-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,83
117	N'-(3-((2-Хлор-5-метилфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 6,87 (dd, 1H), 6,82 (s, 1H), 6,45 (d, 1H), 6,33 (dd, 1H), 3,37 (d, 2H), 3,04 (d, 3H), 2,92 (d, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,85 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,86
118	N'-(2-Хлор-3-((5-хлор-3-метилпіридин-2-іл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,49-7,48 (m, 1H), 6,65 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,13 (d, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,60 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 365,3
119	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фтор-5-метилфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,56 (dd, 1H), 6,28 (d, 1H), 6,11 (s, 1H), 6,04-6,00 (m, 1H), 3,30-3,47 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,0
120	N'-(2-Хлор-3-((2-хлор-5-метилфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,24 (d, 1H), 6,92 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,54 (s, 1H), 6,41 (d, 1H), 3,38 (d, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,3
121	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((2-фтор-6-метилфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,01 (m, 3H), 6,67 (d, 1H), 6,07 (d, 1H), 5,43-5,40 (m, 1H), 3,30-3,49 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,17 (s, 6H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,38
122	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((2-фтор-3-метилфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75-7,61 (m, 1H), 7,12 (s, 1H), 6,94-6,90 (m, 1H), 6,79-6,77 (m, 1H), 6,71-6,66 (m, 1H), 6,36-6,32 (m, 1H), 6,23-6,26 (m, 1H), 3,31-3,48 (m, 2H), 2,91-3,03 (m, 3H), 2,26-2,22 (m, 3H), 2,08 (dd, 3H), 1,16-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,38
123	N'-(2-Хлор-3-((2-фтор-3-метилфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 6,95 (t, 2H), 6,92-6,88 (m, 1H), 6,86-6,82 (m, 1H), 6,37 (d, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,23 (d, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,8
124	N'-(5-Хлор-3-(4-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ

	метилформімідамід	7,69 (brs, 1H), 7,18-7,08 (m, 4H), 6,77 (s, 2H), 3,92 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,10
125	N'-(3-(4-Бромбензил)-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,09 (d, 2H), 6,78 (s, 2H), 3,92 (s, 2H), 3,41-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,00
126	N'-(5-Хлор-3-(4-хлорбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,34 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 6,78 (s, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 3H), 2,89 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 335,05
127	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,51 (m, 4H), 7,42 (d, 1H), 6,86-6,74 (m, 2H), 4,05 (s, 2H), 3,41-3,311 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,17-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,75
128	N'-(5-Хлор-3-(4-фтор-3-метилбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,06-7,01 (m, 2H), 6,97-6,93 (m, 1H), 6,75 (s, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 333,15
129	N'-(5-Хлор-3-(3,4-дифторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,37-7,30 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 6,97-6,94 (m, 1H), 6,82-6,73 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 337,70
130	N'-(5-Хлор-3-(3-хлор-4-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,35-7,30 (m, 2H), 7,14-7,10 (m, 1H), 6,81-6,78 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 354,65
131	N'-(5-Хлор-3-(4-хлор-3-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 6,82-6,79 (m, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,41-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12-1,06 (m, 3H); LCMS (M+1): 353,05
132	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((3-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,23-8,25 (m, 1H), 7,92 (q, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,76-7,64 (m, 1H), 6,86-6,78 (m, 2H), 6,60-6,54 (m, 1H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,93-3,01 (m, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 355,10
133	N'-(2-Хлор-3-((2-фтор-6-метилфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,57-7,73 (m, 1H), 7,19 (td, 1H), 7,13-7,09 (m, 2H), 6,68 (s, 1H), 6,13 (s, 1H), 5,59 (s, 1H), 3,47-3,35 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,16 (t, 3H), 2,04 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,50
134	N'-(2-Хлор-3-((4-хлор-2-фторфеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,42-7,38 (m, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,15 (dt, 1H), 7,01-

		6,97 (m, 1H), 6,44-6,39 (m, 2H), 3,59-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,16 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,24
135	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((3-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,36 (t, 1H), 8,01-7,98 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 6,96 (dd, 1H), 6,62 (s, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,8
136	N'-(3-((4-Хлор-2-фторфеніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,10 (dq, 1H), 6,78 (t, 1H), 6,42 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,79
137	N'-(2-Хлор-3-((3-хлор-5-(трифторметил)феніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,33 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,07-7,05 (m, 2H), 7,00-6,99 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 405,85
138	N'-(2-Хлор-3-((2-фтор-6-метилфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64-7,63 (m, 1H), 7,09 (td, 1H), 7,02-6,97 (m, 2H), 6,56 (d, 1H), 6,39-6,38 (m, 1H), 3,39-3,30 (m, 2H), 3,17-3,15 (m, 3H), 2,97-2,88 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,13 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 347,86
139	N'-(2-Хлор-3-((2-фтор-3-метилфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,83-6,75 (m, 2H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,40
140	N'-(3-((4-Хлор-2-фторфеніл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 6,98-6,75 (m, 3H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,92-3,11 (m, 3H), 2,50-2,55 (m, 3H), 2,15-2,19 (m, 6H), 1,13-1,35 (m, 3H); LCMS (M+1): 347,86
141	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(2-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,31-7,25 (m, 1H), 7,22-7,17 (m, 1H), 7,15-7,11 (m, 1H), 7,08-7,04 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,45-6,42 (m, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 303,40
142	N'-(3-(2-Хлорбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,52-7,47 (m, 1H), 7,30-7,26 (m, 2H), 7,03-7,00 (m, 1H), 6,60 (d, 1H), 6,33-6,30 (m, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,35
143	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,77-7,55 (m, 2H), 7,58 (t, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,04 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,34 (dd, 1H), 4,10 (s,

		2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,17-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 353,40
144	N'-(3-(3-Хлорбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (brs, 1H), 7,32 (t, 1H), 7,27-7,24 (m, 1H), 7,20-7,17 (m, 1H), 7,11 (d, 1H), 6,59 (d, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 3H), 2,92 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,95
145	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((2-фтор-6-метилфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67-7,53 (m, 1H), 7,13-7,08 (m, 1H), 7,04-7,00 (m, 2H), 6,47 (dd, 1H), 6,34-6,27 (m, 1H), 3,40-3,29 (m, 2H), 3,13-3,10 (m, 3H), 2,99-2,83 (m, 3H), 2,10-2,04 (m, 3H), 1,58 (s, 3H), 1,11-1,05 (m, 3H); LCMS (M+1): 331,41
146	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,01-6,91 (m, 3H), 6,56-6,51 (m, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,15
147	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(3-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,35-7,30 (m, 1H), 7,04-6,93 (m, 3H), 6,58 (d, 2H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 302,95
148	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,16-7,09 (m, 2H), 6,86-6,84 (m, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,22-6,19 (m, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,44-3,30 (m, 2H), 2,93 (sz, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,10
149	N'-(3-Бензил-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,31-7,27 (m, 2H), 7,21-7,13 (m, 3H), 6,57-6,52 (m, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,42-3,30 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 285,10
150	N'-(2-Хлор-3-(4-метоксибензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (brs, 1H), 7,10-7,07 (m, 2H), 6,82 (d, 2H), 6,65 (d, 1H), 6,62-6,58 (m, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,44-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,95
151	N'-(3-(2-Бромбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68-7,61 (m, 2H), 7,30 (t, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,03-7,01 (m, 1H), 6,54 (dd, 1H), 6,28 (dd, 1H), 4,01 (s, 2H), 3,41-3,35 (m, 2H), 2,96 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,95
152	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((2-фтор-3-метилфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74-7,62 (m, 1H), 6,98-6,94 (m, 1H), 6,86-6,82 (m, 1H), 6,71 (td, 1H), 6,50-6,43 (m, 2H), 3,45-3,30 (m, 2H), 3,08 (s, 3H), 3,01-2,91 (m, 3H), 2,17 (d, 3H), 1,92-

		1,90 (m, 3H), 1,15-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 332,3
153	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(3-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,55 (d, 1H), 7,99 (dd, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,13 (dd, 1H), 6,60-6,54 (m, 1H), 6,12 (dd, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,94 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,95
154	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(м-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,08 (t, 1H), 6,70-6,67 (m, 3H), 6,62 (d, 1H), 6,52 (s, 1H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,1
155	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(феніламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73-7,61 (m, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,23-7,18 (m, 2H), 6,89 (dd, 2H), 6,82-6,78 (m, 1H), 6,71 (d, 1H), 6,53-6,51 (m, 1H), 3,47-3,29 (m, 2H), 3,02-2,91 (m, 3H), 2,09 (d, 3H), 1,13 (dd, 3H); LCMS (M+1): 302,8
156	N'-(2-Хлор-3-((4-хлор-2-фторфеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72-7,59 (m, 1H), 7,26 (dd, 1H), 7,17-7,14 (m, 1H), 6,94 (t, 1H), 6,63-6,59 (m, 2H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,16-3,11 (m, 3H), 3,02-2,92 (m, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 370,7
157	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(3-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,54-8,52 (m, 1H), 7,99-7,96 (m, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,14-7,11 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,39 (d, 1H), 3,36-3,32 (m, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,83
158	N'-(2-Хлор-3-((3-хлор-5-(трифторметил)феніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,81-7,68 (m, 1H), 7,01 (s, 1H), 6,87-6,85 (m, 1H), 6,81-6,79 (m, 1H), 6,67-6,62 (m, 2H), 3,47-3,30 (m, 2H), 3,23 (s, 3H), 3,02-2,95 (m, 3H), 2,29 (d, 3H), 1,18-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 418,25
159	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,80 (s, 1H), 7,17-7,12 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,67 (t, 1H), 6,49 (d, 2H), 3,54-3,33 (m, 2H), 3,21-3,14 (m, 3H), 2,97 (d, 3H), 1,94 (s, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,05
160	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(м-толіл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,82-7,68 (m, 1H), 7,00-7,00 (m, 1H), 6,85-6,80 (m, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,50-6,48 (m, 1H), 6,34 (s, 1H), 6,27 (dd, 1H), 3,48-3,29 (m, 2H), 3,15-3,12 (m, 3H), 3,02-2,93 (m, 3H), 2,22-2,18 (m, 3H), 1,95 (d, 3H), 1,19-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,1
161	N'-(3-((3-Хлор-5-(трифторметил)феніл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,27 (s, 1H), 7,78-7,66 (m, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,98-6,94 (m, 2H), 6,63-6,53 (m, 2H), 3,49-3,30 (m, 2H), 3,01-2,95 (m, 3H), 2,04 (s,

		3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 388,0
162	N'-(5-Хлор-3-((4-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,98-6,94 (m, 2H), 6,90-6,86 (m, 2H), 6,47 (t, 1H), 6,37 (s, 1H), 3,73 (d, 3H), 3,38 (d, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,0
163	N'-(5-Хлор-3-((3-хлорфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75-7,63 (m, 2H), 7,18-7,14 (m, 1H), 6,76-6,72 (m, 4H), 6,63 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 336,12
164	N'-(3-((3-Бромфеніл)аміно)-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,80-7,65 (m, 2H), 7,15-7,10 (m, 1H), 6,95-6,88 (m, 2H), 6,80-6,75 (m, 2H), 6,66-6,63 (m, 1H), 3,47-3,30 (m, 2H), 3,01-2,94 (m, 3H), 2,10-2,02 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,85
165	N'-(5-Хлор-3-((2-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,62 (m, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,21-7,16 (m, 1H), 7,07-7,03 (m, 1H), 6,93-6,89 (m, 1H), 6,88-6,82 (m, 1H), 6,58-6,54 (m, 1H), 6,46 (t, 1H), 3,48-3,30 (m, 2H), 3,03-2,94 (m, 3H), 2,10-2,05 (m, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 320,1
166	N'-(5-Хлор-3-((3-фторфеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,80-7,64 (m, 2H), 7,22-7,16 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,68-6,63 (m, 2H), 6,55-6,50 (m, 2H), 3,49-3,30 (m, 2H), 3,04-2,90 (m, 3H), 2,09-2,02 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 319,95
167	N'-(5-Хлор-3-((4-метоксифеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (dd, 1H), 6,80-6,75 (m, 3H), 6,69 (d, 1H), 6,51 (td, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,45-3,29 (m, 2H), 3,09 (d, 3H), 3,02-2,91 (m, 3H), 1,93 (t, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 345,9
168	N'-(3-(2-Ціанобензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,86-7,84 (m, 1H), 7,73-7,62 (m, 2H), 7,46-7,43 (m, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,39 (dd, 1H), 4,15 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,93 (m, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,40
169	N'-(2-Хлор-3-((2,3-дигідробензо[b][1,4]діоксин-6-іл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (d, 1H), 7,02 (s, 1H), 6,74 (dd, 1H), 6,59-6,56 (m, 2H), 6,49 (d, 1H), 6,23 (s, 1H), 4,19 (td, 4H), 3,37 (d, 2H), 2,94 (d, 3H), 2,11 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 360,7
170	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (brs, 1H), 7,41-7,37 (m, 2H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,61 (d, 1H), 6,43 (dd, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,43-3,30 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,15
171	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ

	метилформімідамід	7,68 (brs, 1H), 7,09 (d, 2H), 7,02 (d, 2H), 6,55-6,49 (m, 2H), 3,48-3,26 (sm, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,20
172	N'-(3-(4-Хлорбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,35-7,23 (m, 2H), 7,15 (d, 2H), 6,56 (d, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,50-3,26 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 319,10
173	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(3-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brsz, 1H), 7,42 (t, 1H), 7,20-7,13 (m, 3H), 6,59 (d, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,30
174	N'-(3-(3-Ціанобензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70-7,60 (m, 3H), 7,53-7,46 (m, 2H), 6,60 (d, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,15
175	N'-(3-(4-Бромбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,58-7,4 (m, 2H), 7,10 (d, 2H), 6,59-6,55 (m, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,55
176	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(4-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,29-7,24 (m, 4H), 6,58 (d, 2H), 3,97 (s, 2H), 3,41-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,20
177	N'-(2-Хлор-3-((2-(дифторметокси)феніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,66 (d, 1H), 7,33 7,20 (d, 1H), 7,17-7,11 (m, 3H), 6,98-6,93 (m, 1H), 6,79 (s, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,41 (s, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 368,4
178	N'-(5-Хлор-3-((2-фторфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75-7,63 (m, 1H), 7,12-7,07 (m, 2H), 6,98-6,91 (m, 2H), 6,72-6,69 (m, 1H), 6,62 (d, 1H), 3,46-3,29 (m, 2H), 3,10 (s, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 333,95
179	N'-(5-Хлор-3-((3-фторфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (d, 1H), 7,14-7,09 (m, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,44-6,40 (m, 1H), 6,25-6,21 (m, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,15 (d, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,15-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 334,1
180	N'-(5-Хлор-3-((3-хлорфеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,12 (t, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,77 (d, 1H), 6,67-6,65 (m, 1H), 6,43 (t, 1H), 6,37 (dd, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,16-3,13 (m, 3H), 3,00-2,92 (m, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95
181	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((2-	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ

	(трифторметил)бензил)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	7,70 (d, 1H), 7,62-7,51 (m, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,41 (t, 1H), 6,01 (s, 1H), 5,91 (t, 1H), 5,78 (d, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,41 (d, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 384,05
182	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((4-фтор-3-метилбензил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,59 (s, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 7,06-7,02 (m, 1H), 5,89 (d, 1H), 5,79-5,75 (m, 1H), 5,73-5,70 (m, 1H), 4,24 (d, 2H), 3,46-3,35 (m, 1H), 3,28 (d, 1H), 2,90 (s, 3H), 2,19 (d, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,15
183	N'-(5-Хлор-3-((3-хлорбензил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,64 (s, 1H), 7,38-7,26 (m, 4H), 6,15 (s, 1H), 6,00 (d, 1H), 5,84 (t, 1H), 4,35 (d, 2H), 3,37 (d, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95
184	N'-(2-Хлор-3-((2,3-дигідробензо[b][1,4]діоксин-6-іл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,66 (d, 1H), 6,69-6,61 (m, 3H), 6,00-5,98 (m, 2H), 4,15-4,10 (m, 4H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,08-3,04 (m, 3H), 2,98-2,88 (m, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,18-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 374,1
185	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(о-толіламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,72-7,70 (m, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,11 (td, 1H), 6,92 (td, 1H), 6,80-6,77 (m, 2H), 6,44 (s, 1H), 6,19-6,18 (m, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,01-2,91 (m, 3H), 2,16 (s, 3H), 2,08 (d, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,9
186	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(піримідин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,44-8,39 (m, 3H), 7,73-7,61 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,84-6,82 (m, 1H), 6,58-6,55 (m, 1H), 3,03-2,94 (m, 2H), 2,55-2,50 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,8
187	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піримідин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,68 (s, 1H), 8,44-8,38 (m, 2H), 7,75-7,63 (m, 1H), 7,01 (dd, 1H), 6,77 (t, 1H), 6,49 (d, 1H), 3,52-3,28 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,8
188	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,66-7,55 (m, 3H), 7,31 (d, 2H), 6,57-6,55 (m, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,41-3,31 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,08 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,40
189	N'-(2-Бром-3-(3-фторбензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,60 (brs, 1H), 7,30 (t, 6,4 Гц, 1H), 7,02-6,94 (m, 3H), 6,71 (d, 1H), 6,65 (s, 1H), 4,05 (s, 2H), 3,42-3,13 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
190	N-Етил-N'-(3-(3-фторбензил)-5-метил-2-(метилтіо)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,62 (brs, 1H), 7,28 (t, 1H), 7,02-6,90 (m, 3H), 6,71 (d, 1H), 6,55 (s, 1H), 4,17 (s, 2H), 3,46-

		3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,20
191	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(о-толіл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (s, 1H), 7,18-7,13 (m, 2H), 6,96-6,94 (m, 2H), 6,64 (s, 1H), 6,40 (t, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 6H), 1,96 (d, 6H), 1,12 (d, 3H); LCMS (M+1): 330,1
192	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(піримідин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,44-8,39 (m, 1H), 7,73-7,61 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,84-6,82 (m, 2H), 6,58-6,55 (m, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,03-2,94 (m, 2H), 2,55-2,50 (m, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,75
193	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піразин-2-іламіно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,58 (s, 1H), 8,26 (t, 1H), 8,06-8,04 (m, 1H), 7,89 (t, 1H), 7,74-7,61 (m, 1H), 7,15 (dd, 1H), 6,48 (d, 1H), 3,46-3,30 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,11 (d, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 288,1
194	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(піразин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,63 (s, 1H), 8,30 (t, 1H), 8,07-8,06 (m, 1H), 7,92-7,91 (m, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,32 (s, 1H), 6,56 (s, 1H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 304,1
195	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((1-(піразин-2-іл)пропан-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,59-8,57 (m, 2H), 8,47 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 6,18 (s, 1H), 6,03 (s, 1H), 4,84 (d, 1H), 3,97-3,90 (m, 1H), 3,42-3,32 (m, 2H), 3,11 (q, 1H), 2,91-2,99 (m, 4H), 2,16 (d, 3H), 1,10-1,19 (m, 6H); LCMS (M+1): 345,85
196	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(((5-метилпіразин-2-іл)метил)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,49 (d, 1H), 8,45 (s, 1H), 7,63-7,53 (m, 1H), 6,07 (d, 2H), 5,89 (t, 1H), 4,45 (d, 2H), 3,38 (d, 1H), 3,28 (s, 1H), 2,92 (d, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,10 (d, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,15
197	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((1-(піразин-2-іл)пропан-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,57 (q, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,59 (s, 1H), 6,04 (dd, 1H), 5,91 (d, 1H), 4,75 (d, 1H), 3,83 (dt, 1H), 3,33-3,35 (m, 1H), 3,29-3,24 (m, 1H), 3,09 (q, 1H), 2,87 (dd, 4H), 1,93-1,88 (m, 3H), 1,15 (d, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 330,15
198	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(((5-метилпіразин-2-іл)метил)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,47 (s, 1H), 8,44 (d, 1H), 7,62-7,53 (m, 1H), 5,94 (d, 1H), 5,86-5,81 (m, 2H), 4,41 (d, 2H), 3,37 (d, 1H), 3,21-3,30 (1H), 2,90 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,4
199	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піразин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,10 (q, 1H), 7,81-7,62 (m, 2H), 7,52 (s, 1H), 6,78-6,70 (m, 2H), 3,34-3,35 (m, 2H), 3,28 (d, 3H), 2,96 (d, 3H), 1,94-1,87 (m, 3H), 1,16-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 302,15

200	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(піримідин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,31 (s, 2H), 7,71 (d, 1H), 6,67-6,60 (m, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,31 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,87 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 301,85
201	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,57-7,51 (m, 3H), 7,44 (d, 1H), 6,60 (d, 2H), 4,05 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 353,50
202	N'-(3-(4-Ціанобензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,74 (m, 2H), 7,69 (brs, 1H), 7,33 (d, 2H), 6,60 (d, 2H), 4,04 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,45
203	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(4-фтор-3-метилбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,05-7,01 (m, 2H), 6,97-6,94 (m, 1H), 6,57-6,51 (m, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (d, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,50
204	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(4-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,66 (brs, 1H), 7,16-7,12 (m, 2H), 7,11-7,05 (m, 2H), 6,61-6,51 (m, 2H), 3,90 (s, 2H), 3,40-3,30 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 303,20
205	N'-(3-(3-Бромбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,39-7,36 (m, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,13 (d, 1H), 6,57 (d, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,50
206	N'-(3-(4-Хлор-3-фторбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (brs, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 6,97 (d, 1H), 6,57 (d, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,40-3,31 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 337,10
207	N'-(3-Бензил-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,53 (brs, 1H), 7,26-7,22 (m, 2H), 7,16-7,09 (m, 3H), 6,58 (s, 1H), 6,46 (s, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,48-3,33 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,09 (t, 3H); LCMS (M+1): 281,50
208	N'-(2,5-Диметил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,53 (brs, 1H), 7,12 (t, 1H), 6,96-6,87 (m, 3H), 6,57 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 3,82 (s, 2H), 3,49-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 295,50
209	N'-(2-Бром-5-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,19 (dd, 1H), 7,15-7,08 (m, 2H), 6,88-6,86 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 6,40 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS

		(M+1): 360,50
210	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(піразин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,10 (q, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 6,84 (d, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,27 (d, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,18-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,85
211	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(піразин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,60 (s, 1H), 8,25-8,23 (m, 1H), 8,06-8,04 (m, 1H), 7,90-7,88 (m, 1H), 7,76-7,63 (m, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,68-6,65 (m, 1H), 3,48-3,31 (m, 2H), 3,03-2,91 (m, 3H), 2,14-2,09 (m, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 304,00
212	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(піримідин-2-іламіно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,72 (s, 1H), 8,37 (d, 2H), 7,66 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,75 (t, 1H), 6,67 (s, 1H), 3,41-3,35 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 304,1
213	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(піразин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,12-8,10 (m, 1H), 7,83-7,72 (m, 2H), 7,55 (d, 1H), 6,97-6,92 (m, 2H), 3,47-3,35 (m, 2H), 3,31 (d, 3H), 2,99 (d, 3H), 1,96 (d, 3H), 1,16 (t, 3H); LCMS (M+1): 318,4
214	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(піримідин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,33 (s, 2H), 7,73 (d, 1H), 6,87-6,85 (m, 2H), 6,70-6,67 (m, 1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,97-2,91 (m, 3H), 3,02-2,90 (m, 3H), 1,89 (s, 3H), 1,20-1,13 (m, 3H); LCMS (M+1): 317,8
215	N'-(3-(2-Бром-4-фторбензил)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70-7,58 (m, 2H), 7,19 (td, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,45 (d, 1H), 4,03 (s, 2H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14-1,06 (m, 3H); LCMS (M+1): 399,05
216	N'-(3-(4-Бром-3-метилбензил)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,66 (brs, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,90 (dd, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,65 (s, 1H), 3,93 (s, 3H), 3,41-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 395,05
217	N'-(3-(4-Бром-2-фторбензил)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,52 (dd, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,63 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 398,85
218	N'-(2-Хлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)бензил)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 2H), 7,54-7,50 (m, 1H), 7,44-7,40 (m, 1H), 6,78-6,70 (m, 2H), 4,08 (s, 2H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 388,20
219	N-Етил-N'-(3-(2-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,56 (brs, 1H), 7,26-7,21 (m, 1H), 7,18-7,13 (m, 1H), 7,11-7,05 (m, 1H), 7,03-6,96 (m, 1H),

		6,49 (d, 2H), 3,86 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,45
220	N'-(3-(2-Хлорбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,56 (brs, 1H), 7,44-7,40 (m, 1H), 7,23-7,17 (m, 1H), 6,90-6,84 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 6,39 (s, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,42-3,29 (m, 2H), 2,88 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,08 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,05
221	N'-(3-(2-Бромбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,63-7,59 (m, 1H), 7,26 (td, 1H), 7,15 (td, 1H), 6,89 (dd, 1H), 6,50 (s, 1H), 6,40 (s, 1H), 3,92 (m, 2H), 3,46-3,32 (3H), 2,90 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 359,40
222	N-Етил-N'-(3-(4-фторбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72-7,40 (1H), 7,15-7,06 (m, 4H), 6,59 (s, 1H), 6,48 (s, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 299,40
223	N'-(3-(4-Бромбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,59-7,45 (m, 3H), 7,09 (d, 2H), 6,61 (s, 1H), 6,51 (s, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,48-3,27 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 361,15
224	N'-(3-(4-Хлорбензил)-2,5-диметилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64-7,52 (m, 1H) 7,33-7,30 (m, 2H), 7,14-7,11 (m, 2H), 6,59 (s, 1H), 6,49 (s, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,05
225	N'-(3-(Бензо[d]тіазол-6-іламіно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,06 (d, 1H), 7,90 (dd, 1H), 7,73 (d, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,15 (dd, 1H), 6,57 (dd, 1H), 6,39 (s, 1H), 3,35 (d, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 343,25
226	N'-(2-Хлор-3-((6-етилпіридин-2-іл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,90 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,55-7,54 (m, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,45 (s, 1H), 3,46-3,32 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,62 (q, 2H), 2,23 (s, 3H), 1,23 (t, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,85
227	N-Етил-N'-(3-((6-етилпіридин-2-іл)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,97 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,46-7,41 (m, 1H), 7,31-7,25 (m, 1H), 6,63-6,57 (m, 2H), 6,38 (d, 1H), 3,51-3,32 (m, 2H), 2,97 (d, 3H), 2,60 (q, 2H), 2,12 (s, 3H), 1,24-1,19 (m, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,85
228	N'-(3-(Бензо[d]тіазол-6-іламіно)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,10 (d, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,76-7,60 (m, 3H), 7,27-7,19 (m, 1H), 6,76-6,75 (m, 1H), 6,44 (s,

		1H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,98 (d, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 359,35
229	N'-(3-(2-Хлор-5-фторбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (brs, 1H), 7,55 (dd, 1H), 7,17 (t, 1H), 6,81 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,35 (dd, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,50-3,32 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 338,00
230	N'-(3-(2-Бром-4-фторбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,76-7,60 (m, 2H), 7,23-7,18 (m, 1H), 7,05-7,01 (m, 1H), 6,62-6,59 (m, 1H), 6,29 (dd, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,50-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,17-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 383,00
231	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(5-фтор-2-метилбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73 (brs, 1H), 7,25-7,22 (m, 1H), 6,96 (td, 1H), 6,59 (dd, 2H), 6,27 (dd, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,50-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,30
232	N'-(3-(4-Бром-3-метилбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,58-6,53 (m, 2H), 3,87 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 378,25
233	N'-(3-(2-Бром-5-фторбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,79-7,63 (m, 2H), 7,12-7,07 (m, 1H), 6,79 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,33 (dd, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,51-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 383,15
234	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)бензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,73-7,54 (m, 2H), 7,49-7,39 (m, 2H), 6,59 (d, 2H), 4,02 (s, 2H), 3,49-3,31 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 371,50
235	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(3-фтор-5-метилбензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,86-6,82 (m, 2H), 6,72 (d, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,50-3,38 (m, 2H), 2,952 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 317,50
236	N'-(3-(4-Бром-2-фторбензил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (brs, 1H), 7,53 (dd, 1H), 7,35 (dd, 1H), 7,00 (t, 1H), 6,63-6,54 (m, 1H), 6,46 (dd, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,54-3,32 (m, 2H), 2,952 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 382,30
237	N-Етил-N'-(5-фтор-3-(3-фтор-5-метоксибензил)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (brs, 1H), 6,67-6,63 (m, 1H), 6,58-6,54 (m, 3H), 6,51-6,48 (m, 1H), 3,91 (s, 2H), 3,74 (s, 3H), 3,48-3,38 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,55
238	N'-(3-(Бензо[d]тіазол-6-іл(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,98 (s, 1H), 7,79-7,68 (m, 2H),

		7,23 (d, 1H), 6,71-6,66 (m, 1H), 6,60 (ddd, 2H), 3,46-3,34 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 357,3
239	N-Етил-N'-(3-((6-етилпіридин-2-іл)(метил)аміно)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,26 (dd, 1H), 6,70 (d, 1H), 6,61 (dd, 1H), 6,45 (d, 1H), 5,82 (d, 1H), 3,34-3,47 (m, 2H), 3,27 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,60 (q, 2H), 1,89 (s, 3H), 1,22 (q, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,35
240	N'-(3-(Бензо[d]тіазол-6-іл(метил)аміно)-2-хлор-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,98 (s, 1H), 7,78-7,65 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 6,77 (d, 2H), 6,61 (dd, 2H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,96 (d, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 374,05
241	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(4-(метилтіо)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,16 (m, 2H), 7,08 (d, 2H), 6,56-6,52 (m, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,48-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,55
242	N'-(3-(Бензо[d]тіазол-6-іламіно)-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,04-9,10 (m, 1H), 7,89-7,96 (m, 1H), 7,71-7,77 (m, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,12 (dd, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,61 (s, 1H), 3,45-3,33 (m, 3H), 3,01-2,94 (m, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 360,1
243	N'-(5-Хлор-3-((6-етилпіридин-2-іл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,01 (s, 1H), 7,72-7,71 (m, 1H), 7,47-7,46 (m, 1H), 7,44-7,42 (m, 1H), 6,60-6,55 (m, 3H), 3,46-3,30 (m, 2H), 3,00-2,94 (m, 3H), 2,59 (q, 2H), 2,12 (s, 3H), 1,23-1,18 (m, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 332,1
244	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,3-7,36 (m, 1H), 7,33-7,30 (m, 1H), 7,26-7,21 (m, 1H), 7,12 (d, 1H), 6,79-6,77 (m, 2H), 3,93 (s, 2H), 3,39-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,15
245	N'-(3-(3-Бромбензил)-5-хлор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75-7,61 (m, 2H), 7,58-7,52 (m, 1H), 7,44 (t, 1H), 7,02 (d, 1H), 6,81-6,78 (m, 1H), 6,54 (d, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,42-3,34 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,10
246	N'-(5-Хлор-3-(4-ціанобензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74-7,72 (m, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,31 (d, 2H), 6,81-6,78 (m, 2H), 4,02 (s, 2H), 3,91-3,36 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,45
247	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,36-7,33 (m, 2H), 7,32-7,27 (m, 1H), 7,06-7,04 (m, 1H), 6,79 (s, 1H), 6,64 (d, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,46-3,32 (m, 2H),

		2,90 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,15
248	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(піридин-3-ілметил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,41-8,38 (m, 2H), 7,69 (s, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,30-7,28 (m, 1H), 6,79 (s, 2H), 3,95 (s, 2H), 3,98-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 302,45
249	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,54 (m, 3H), 7,33 (d, 2H), 6,82-6,78 (m, 2H), 4,03 (s, 2H), 3,39-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,10 (d, 3H); LCMS (M+1): 370,10
250	N'-(5-Хлор-3-(3-ціанобензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,58 (m, 3H), 7,51-7,44 (m, 2H), 6,81-6,78 (m, 2H), 3,99 (s, 2H), 3,40-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 326,20
251	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(3-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,44-7,36 (m, 1H), 7,18-7,11 (m, 3H), 6,80-6,77 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,95-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 386,00
252	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(4-(метилтіо)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (s, 1H), 7,21-7,17 (m, 2H), 7,08 (d, 2H), 6,76 (s, 2H), 3,89 (s, 2H), 3,41-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,10
253	N'-(5-Хлор-3-((6-етилпіридин-2-іл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (d, 1H), 7,30-7,26 (m, 1H), 6,89 (d, 1H), 6,84-6,83 (m, 1H), 6,49-6,46 (m, 1H), 5,84 (d, 1H), 3,46-3,35 (m, 2H), 3,31 (d, 3H), 2,94-3,02 (m, 3H), 2,62 (q, 2H), 1,93 (s, 3H), 1,22 (t, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,0
254	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64 (d, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,79 (dd, 1H), 6,72 (dt, 1H), 6,38 (dd, 1H), 6,26 (d, 1H), 3,76 (s, 3H), 3,40 (d, 2H), 2,94 (d, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 334,4
255	N'-(2-Хлор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,70 (s, 1H), 7,29 (s, 1H), 7,09-7,04 (m, 1H), 6,93 (dd, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,32 (s, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 351,0
256	N'-(5-Хлор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,06 (t, 1H), 6,78 (dd, 1H), 6,72 (dq, 1H), 6,61 (d, 1H), 6,49-6,47 (m, 1H), 3,77 (d, 3H), 3,43-3,31 (m, 2H), 3,01-2,93 (m, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,16-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 350,35
257	N-Етил-N'-(5-фтор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71 (d, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,64

	метилформімідамід	(d, 1H), 6,52 (dd, 1H), 6,36 (dd, 1H), 6,22-6,19 (m, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,35-3,44 (m, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,90 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,0
258	N'-(2-Хлор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,67 (d, 1H), 6,95 (t, 1H), 6,73-6,68 (m, 2H), 6,33 (dd, 1H), 6,21 (dt, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,38 (dt, 2H), 3,11 (d, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,25 (d, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,15
259	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(3-нітробензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,06-8,03 (m, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,69-7,55 (m, 3H), 6,63-6,58 (m, 2H), 4,08 (s, 2H), 3,47-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,21-1,09 (m, 3H); LCMS (M+1): 330,45
260	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(піридин-3-ілметил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 8,41-8,35 (m, 2H), 7,67 (s, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,29 (dd, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,94 (s, 2H), 3,40-3,35 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 286,20
261	N-Етил-N'-(3-(4-фторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,59 (s, 1H), 7,15-7,11 (m, 2H), 7,09-7,04 (m, 2H), 6,35 (d, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,86 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,45
262	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(2-метилбензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,63 (s, 1H), 7,18-7,15 (m, 1H), 7,11-7,04 (m, 2H), 6,80-6,78 (m, 1H), 6,26 (d, 1H), 6,08 (d, 1H), 3,81 (s, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,43-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,45
263	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(4-метилбензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,58 (s, 1H), 7,05 (d, 2H), 6,99 (d, 2H), 6,33 (d, 1H), 6,24 (d, 1H), 3,82 (s, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,40
264	N'-(3-(3-Хлорбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,61 (s, 1H), 7,29 (t, 1H), 7,23-7,20 (m, 1H), 7,12 (d, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,38 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,49-3,32 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,12-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 332,00
265	N'-(3-(2-Хлорбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,64 (s, 1H), 7,47-7,44 (m, 1H), 7,26-7,20 (m, 2H), 6,95-6,93 (m, 1H), 6,31 (d, 1H), 6,17 (d, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,45-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,10
266	N-Етил-N'-(3-(2-фторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,61 (s, 1H), 7,27-7,21 (m, 1H), 7,18-7,13 (m, 1H), 7,10-7,06 (m, 1H), 7,02-6,97 (m, 1H), 6,27 (s,

		2H), 3,87 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,35
267	N'-(5-Хлор-3-((3-фтор-4-метоксифеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,72 (d, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,81 (d, 1H), 6,72 (s, 1H), 6,36 (dd, 1H), 6,20 (d, 1H), 3,70 (d, 3H), 3,44-3,34 (m, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 1,92 (s, 3H), 1,23-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 364,1
268	N-Етил-N'-(5-метокси-3-((2-метоксифеніл)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64 (s, 1H), 6,95-6,92 (m, 1H), 6,78-6,69 (m, 3H), 6,35 (s, 1H), 6,31 (d, 1H), 6,10 (d, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,64 (s, 3H), 3,35 (s, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 328,35
269	N-Етил-N'-(3-((3-фтор-4-метоксифеніл)аміно)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,58 (d, 1H), 7,16 (s, 1H), 6,98 (t, 1H), 6,68 (dd, 1H), 6,62 (dt, 1H), 6,26 (d, 1H), 6,05 (d, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,63 (s, 3H), 3,45 (s, 1H), 3,25-3,30 (1H), 2,92 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,35
270	N-Етил-N'-(5-метокси-3-((2-метоксифеніл)(метил)аміно)-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,57 (d, 1H), 6,98-6,92 (m, 2H), 6,77-6,73 (m, 1H), 6,58-6,56 (m, 1H), 6,28 (d, 1H), 6,11 (s, 1H), 3,74-3,71 (m, 3H), 3,67 (d, 3H), 3,38 (d, 1H), 3,27 (d, 1H), 3,00 (d, 3H), 2,86 (s, 3H), 1,66 (d, 3H), 1,29-1,19 (m, 1H), 1,15-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 342,4
271	N-Етил-N'-(3-((3-фтор-4-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65 (d, 1H), 6,94 (t, 1H), 6,34-6,26 (m, 1H), 6,18 (dt, 1H), 3,69 (d, 6H), 3,38-3,33 (m, 2H), 3,07 (d, 3H), 2,93 (d, 3H), 1,85 (s, 3H), 1,22 (s, 2H), 1,14-1,08 (m, 3H); LCMS (M+1): 360,55
272	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-((6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,62 (d, 1H), 7,72-7,68 (m, 1H), 7,07 (dd, 2H), 6,85-6,83 (m, 1H), 6,79 (t, 1H), 6,25 (s, 1H), 3,71 (d, 3H), 3,32 (s, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 367,0
273	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,67 (s, 1H), 7,75-7,62 (m, 2H), 7,11 (d, 1H), 7,06 (dd, 1H), 6,96 (d, 1H), 6,49 (d, 1H), 3,40 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 354,95
274	N'-(5-Хлор-2-метил-3-((6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,69 (d, 1H), 7,74-7,63 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,92 (d, 1H), 6,69 (s, 1H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,95
275	N'-(2-Хлор-3-((4-фтор-3-метоксифеніл)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,63 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,04

		(dd, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,58-6,55 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 3,76 (s, 3H), 3,40 (d, 2H), 2,95 (d, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 349,95
276	N-Етил-N'-(3-((4-фтор-3-метоксифеніл)аміно)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,60 (d, 1H), 7,21 (s, 1H), 6,96 (dd, 1H), 6,67 (dd, 1H), 6,34 (td, 2H), 6,05 (d, 1H), 3,72 (d, 3H), 3,63 (s, 3H), 3,42 (d, 1H), 2,92 (s, 3H), 1,98 (d, 3H), 1,22 (s, 1H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 346,0
277	N-Етил-N'-(3-(3-фторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,62 (s, 1H), 7,33-7,28 (m, 1H), 7,02-6,97 (m, 2H), 6,93-6,89 (m, 1H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (d, 1H), 3,92 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,42-3,31 (s, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 315,25
278	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(3-метилбензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (brs, 1H), 7,15 (t, 1H), 6,99-6,95 (m, 2H), 6,91 (d, 1H), 6,36 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,84 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,40-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,02 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 311,25
279	N'-(3-(4-Хлорбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,34-7,30 (m, 2H), 7,15-7,12 (m, 2H), 6,37 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 331,05
280	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(3-нітробензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,07-8,04 (m, 1H), 7,97-7,95 (m, 1H), 7,65-7,56 (m, 3H), 6,44 (d, 1H), 6,32 (d, 1H), 4,06 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,46-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,01 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 342,10
281	N-Етил-N'-(3-(5-фтор-2-метилбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (s, 1H), 7,23-7,20 (m, 1H), 6,93 (td, 1H), 6,53 (dd, 1H), 6,32 (s, 1H), 6,15 (d, 1H), 3,83 (s, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,48-3,31 (m, 2H), 2,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 329,00
282	N'-(3-(3-Хлор-4-фторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (s, 1H), 6,90-6,81 (m, 2H), 6,72 (d, 1H), 6,56 (d, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,42-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,68 (s, 3H), 2,09 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 350,90
283	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,72 (s, 1H), 7,77-7,73 (m, 2H), 7,28 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,02 (d, 1H), 6,59-6,57 (m, 1H), 3,45-3,30 (m, 2H), 3,02-2,95 (m, 3H), 2,23 (s, 3H), 1,15 (t, 3H); LCMS (M+1): 370,9
284	N-Етил-N'-(3-((4-фтор-3-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,71-7,69 (m, 1H), 6,92 (dd, 1H), 6,35 (s, 1H), 6,30-6,27 (m,

		2H), 5,87 (td, 1H), 3,73-3,69 (m, 6H), 3,44-3,32 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 3,01-2,92 (m, 3H), 1,90-1,88 (m, 3H), 1,17-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 360,05
285	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(метил(6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,63-7,74 (m, 1H), 7,54-7,58 (m, 2H), 7,00-7,02 (m, 1H), 6,44-6,46 (m, 2H), 6,24 (d, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,48-3,28 (m, 2H), 3,03-2,90 (m, 3H), 1,90-1,87 (m, 3H), 1,31-1,23 (m, 2H), 1,09-1,16 (m, 3H); LCMS (M+1): 381,05
286	N'-(3-(3,4-Дифторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,35-7,28 (m, 1H), 7,14-7,11 (m, 1H), 6,95-6,93 (m, 1H), 6,38 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,89 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,45-3,32 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,00 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 333,40
287	N'-(3-(4-Бромбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 7,46-7,44 (m, 1H), 7,08 (d, 2H), 6,37 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,87 (s, 2H), 3,68 (s, 4H), 3,47-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 376,15
288	N'-(2-Хлор-3-((4-фтор-3-метоксифеніл)(метил)аміно)-5-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,67 (d, 1H), 6,91 (dd, 1H), 6,73-6,69 (m, 2H), 6,30 (dd, 1H), 5,88 (td, 1H), 3,73 (s, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,95 (d, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,22 (s, 2H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 363,8
289	N'-(5-Хлор-2-метил-3-(метил(6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,83-7,72 (m, 1H), 7,61 (t, 1H), 7,06 (d, 1H), 6,97-6,93 (m, 2H), 6,28 (t, 1H), 3,48-3,31 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,03-2,92 (m, 3H), 1,93 (s, 3H), 1,24 (s, 1H), 1,18-1,11 (m, 3H); LCMS (M+1): 369,0
290	N'-(2-Хлор-5-метил-3-(метил(6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,62-7,57 (m, 1H), 7,07-7,04 (m, 1H), 6,88-6,84 (m, 2H), 6,28 (d, 1H), 3,48-3,32 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 2,98 (d, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,18-1,12 (m, 3H); LCMS (M+1): 384,75
291	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-(метил(6-(трифторметил)піридин-2-іл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69-7,88 (1H), 7,59 (d, 1H), 7,06-7,04 (m, 1H), 6,73 (dd, 2H), 6,26 (s, 1H), 3,49-3,31 (m, 3H), 2,98 (d, 3H), 1,92 (d, 3H), 1,25 (d, 2H), 1,15 (d, 3H); LCMS (M+1): 369,0
292	N-Етил-N'-(3-(3-фтор-5-метилбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61 (s, 1H), 6,80 (d, 2H), 6,66 (d, 1H), 6,36 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,85 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,45-3,37 (s, 1H), 2,90 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 328,80
293	N'-(3-(2-Хлор-5-фторбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,65-7,49 (m, 2H), 7,12 (td, 1H), 6,70 (dd, 1H), 6,31 (s, 1H),

		6,21-6,19 (m, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 348,80
294	N'-(3-(2-Бромбензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,63-7,54 (m, 2H), 7,27 (t, 1H), 7,15 (t, 1H), 6,92 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 6,16 (d, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,46-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,99 (d, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 374,75
295	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(4-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,64-7,43 (m, 3H), 7,33 (d, 2H), 6,39 (d, 1H), 6,28 (d, 1H), 3,98 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 365,30
296	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(3-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,61-7,47 (m, 4H), 7,41 (d, 1H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,99 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,47-3,31 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
297	N'-(5-Ціано-3-(3-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,75 (s, 1H), 7,34-7,28 (m, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,18-7,14 (m, 1H), 7,07-6,93 (m, 3H), 4,00 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,89 (m, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,17-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 309,80
298	N'-(3-Бензил-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,58 (s, 1H), 7,27-7,22 (m, 2H), 7,16-7,10 (m, 3H), 6,35 (d, 1H), 6,25 (d, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,45-3,29 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 297,30
299	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,56-7,63 (m, 1H), 7,37-7,25 (m, 3H), 7,01 (d, 1H), 6,29-6,26 (m, 2H), 3,91 (s, 2H), 3,65 (s, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,11 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,35
300	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-((2-(трифторметокси)феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,62 (d, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,11-7,07 (m, 1H), 6,75-6,71 (m, 1H), 6,53 (dd, 1H), 6,27 (d, 1H), 6,24 (s, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,36 (d, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,91 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,8
301	N'-(5-Хлор-2-метил-3-((2-(трифторметокси)феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,69 (d, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 6,83 (td, 1H), 6,67-6,59 (m, 3H), 3,43-3,34 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,8
302	N'-(2-Хлор-5-метил-3-((2-(трифторметокси)феніл)аміно)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,66 (d, 1H), 7,31 (dt, 1H), 7,24-7,20 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 7,00-6,92 (m, 2H), 6,55 (d, 1H), 6,48 (s, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,96 (d, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,22 (s,

		¹ H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 385,7
303	N-Етил-N'-(5-фтор-2-метил-3-((2-трифторметокси)феніл)аміно)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,68 (d, 1H), 7,37 (s, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,17-7,13 (m, 1H), 6,83 (td, 1H), 6,66 (dd, 1H), 6,47 (d, 1H), 6,38 (dd, 1H), 3,43-3,33 (m, 2H), 2,95 (d, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 369,8
304	N'-(3-(2-(2-Хлор-4-метоксифенокс)ацетил)-5-фтор-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,22 (dd, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 6,82 (dd, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,45-3,34 (m, 2H), 2,93 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 392,80
305	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(3-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,60 (s, 1H), 7,39 (t, 1H), 7,15-7,09 (m, 3H), 6,38 (d, 1H), 6,27 (d, 1H), 3,94 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,46-3,32 (m, 1H), 2,89 (s, 3H), 1,99 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 381,35
306	N'-(3-(3-Ціанобензил)-5-метокси-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,66-7,44 (m, 5H), 6,39 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 3,95 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,98 (s, 3H), 1,10 (t, 3H); LCMS (M+1): 322,30
307	N-Етил-N'-(5-метокси-2-метил-3-(2-(трифторметил)бензил)феніл)-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,33 (s, 1H), 6,21 (d, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,48-3,31 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 1,95 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 364,80
308	N'-(3-Бензил-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,60 (s, 1H), 7,31-7,28 (m, 2H), 7,22-7,17 (m, 1H), 7,16-7,13 (m, 4H), 4,00 (s, 2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,92 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 291,80
309	N'-(5-Ціано-3-(3-ціанобензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,77-7,66 (m, 2H), 7,63-7,62 (m, 1H), 7,53-7,47 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,45-3,33 (m, 2H), 2,92 (m, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,14 (t, 3H); LCMS (M+1): 316,80
310	N'-(5-Ціано-3-(4-фторбензил)-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,24-7,06 (m, 6H), 3,96 (s, 2H), 3,42-3,31 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 310,3
311	N'-(3-(4-Хлорбензил)-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,74 (s, 1H), 7,34-7,30 (m, 2H), 7,16-7,12 (m, 4H), 3,97 (s, 2H), 3,42-3,32 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,14-1,10 (m, 3H); LCMS (M+1): 326,05
312	N'-(5-Ціано-2-метил-3-(3-нітробензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,09-8,03 (m, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,61-7,56 (m, 2H), 7,25 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 4,15 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,91

		(s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,14-1,07 (m, 3H); LCMS (M+1): 337,30
313	N'-(3-(3-Бромбензил)-5-ціано-2-метилфеніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,75 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,19-7,11 (m, 3H), 3,99 (s, 2H), 3,43-3,32 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 1,12 (t, 3H); LCMS (M+1): 371,70
314	N'-(5-Ціано-2-метил-3-(2-(трифторметокси)бензил)феніл)-N-етил-N-метилформімідамід	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,77 (s, 1H), 7,40-7,28 (m, 3H), 7,17 (d, 1H), 7,04 (d, 2H), 4,01 (s, 2H), 3,44-3,33 (m, 2H), 2,91 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,13 (t, 3H); LCMS (M+1): 375,75

* Назви сполук, отриманих із застосуванням Chemdraw Professional 17.1

Як описано в даному документі, сполуки загальної формули (I) демонструють фунгіцидну активність, яку вони надають щодо численних фітопатогенних грибів, які вражають важливі сільськогосподарські культури. Сполуки за даним винаходом оцінювали щодо їхньої активності, як описано в наступних випробуваннях.

Приклади біологічного випробування, випробування in vitro

Приклад 1. *Pyricularia oryzae* (пірикуляріоз рису)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 60 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 44 45 46 47 48 49 50 51 52 54 55 56 57 58 59 60 61 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 75 76 77 78 79 80 82 83 86 87 88 89 90 91 92 93 94 96 97 98 100 101 102 103 104 105 107 108 111 112 113 114 115 116 117 118 119 120 121 122 123 124 125 126 127 128 129 130 131 133 134 135 136 137 138 139 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 154 155 157 159 160 161 162 163 164 165 166 167 168 169 170 171 172 173 174 175 176 177 178 179 181 182 183 185 188 189 190 191 201 202 203 204 205 206 207 208 213 214 216 217 218 219 220 221 222 223 224 225 228 229 230 231 232 233 234 235 236 237 238 240 241 242 243 244 245 246 247 248 249 250 251 252 253 254 255 259 261 262 263 264 265 266 267 271 272 273 274 275 276 286 287 288 289 290 291 292 293 294 295 296 297 298 299 300 301 302 303 304 305 306 307 308 309 310 311 313 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 2. *Rhizoctonia solani* (хвороба епідермісу рису/чорна парша картоплі)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 60 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 1 2 3 4 5 6 7 9 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 34 35 37 38 42 44 45 46 48 50 51 52 54 55 56 58 59 60 61 64 65 67 68 69 70 71 72 73 75 76 77 79 80 82 83 84 87 88 89 90 91 92 93 94 96 98 100 102 103 104 105 113 124 125 126 127 128 129 130 131 133 134 135 136 138 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 154 161 162 163 164 165 167 168 169 170 171 172 173 174 175 176 177 178 181 182 183 185 188 189 190 191 201 202 203 204 205 206 207 208 209 213 214 216 217 218 219 220 221 222 223 224 229 230 231 232 233 234 235 236 237 239 241 242 243 244 245 246 247 253 254 255 259 260 261 262 263 264 265 266 273 274 275 276 286 287 292 293 294 295 296 298 299 300 301 302 303 305 306 307 308 311 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 3. *Botrytis cinerea* (сіра гниль)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 22 °C і 90 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 2 3 4 5 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 24 25 26 27 29 31 32 33 34 35 37 38 40 41 42 43 44 45 46 50 51 52 54 55 56 57 58 59 60 62 63 65 67 68 70 71 72 73 76 77 79 80 81 83 84 87 88 89 90 91 92 93 94 96 98 100 102 103 105 106 110 117 118 119 122 123 124 125 126 128 129 133 134 136 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 159 160 161 163 164 166 170 171 172 173 174 175 176 178 179 181 182 183 185 188 191 201 202 203 204 205 206 207 208 213 216 217 220 221 222 223 224 229 230 231 232 233 235 236 237 244 245 246 247 259 261 262 263 264 265 273 274 286 287 288 292 293 294 295 296 297 299 301 302 303 305 307 308 310 311 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне

поширення хвороби.

Приклад 4. *Alternaria solani* (альтернаріоз томатів/картоплі)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 60 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 74 75 76 77 78 79 80 81 82 83 84 85 86 87 88 89 90 91 92 93 94 96 98 100 101 102 103 104 105 106 108 110 112 113 114 115 116 117 118 119 120 121 123 124 125 126 127 128 129 130 131 133 136 137 138 140 142 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 153 154 155 156 157 159 160 161 162 163 164 165 166 167 168 169 170 171 172 173 174 175 176 177 178 179 180 181 182 183 185 188 189 190 191 201 202 203 204 205 206 207 208 209 213 214 216 217 218 219 220 221 222 223 224 225 226 227 228 229 230 231 232 233 234 235 236 237 238 239 240 241 242 243 244 245 246 247 253 254 255 259 260 261 262 263 264 265 266 268 269 271 272 273 274 275 276 286 287 288 289 290 291 292 293 294 295 296 297 298 299 300 301 302 303 304 305 306 307 308 310 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 5. *Colletotrichum capsici* (антракноз)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 60 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 1 2 3 4 5 7 9 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 23 24 25 26 27 31 34 35 36 37 38 39 40 41 44 45 46 48 50 51 56 58 59 60 61 62 65 67 68 71 73 75 77 79 88 89 90 91 92 93 94 96 98 100 101 102 103 105 112 113 114 115 116 118 120 123 124 125 126 128 129 131 133 139 143 144 150 152 156 161 162 163 171 172 181 183 189 190 201 203 204 207 208 209 213 216 217 219 220 221 222 223 224 225 226 233 235 236 244 245 246 254 255 263 275 287 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 6. *Septoria lycopersici* / *Corynespora cassicola* (CORYCA) (плямистість листів томатів)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 70 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 2 3 4 5 6 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 22 23 24 25 29 30 31 35 36 37 38 43 44 50 51 52 54 55 56 58 59 60 67 70 72 73 76 77 79 84 89 91 92 94 96 100 101 103 112 113 114 115 116 117 118 119 120 121 123 124 125 126 128 129 130 131 133 136 138 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149 151 159 161 162 163 164 165 166 188 189 191 201 203 204 205 206 207 208 209 213 214 216 217 219 220 221 222 223 224 226 235 236 237 243 259 261 262 263 264 265 266 271 272 273 274 275 276 286 287 291 292 293 294 295 296 297 299 300 301 302 303 305 307 308 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 7. *Fusarium culmorum* (прикоренева гниль злаків)

Сполуки розчиняли в 0,3 % диметилсульфоксиді та потім додавали в картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. 5 мл середовища зі сполукою у необхідній концентрації розподіляли в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і 60 % відносної вологості протягом семи днів і потім радіальний зріст вимірювали і порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 1 2 3 4 5 12 13 17 18 20 25 26 35 44 46 51 52 54 55 56 59 73 77 87 88 105 112 116 120 124 125 126 129 142 162 163 164 188 190 204 207 208 214 220 221 222 223 224 236 246 261 262 263 264 265 266 271 275 286 287 292 293 294 295 299 305 307 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклади біологічного випробування на рослинах in vivo

Приклад А. Випробування щодо *Pyricularia oryzae* на прикладі рису

Сполуки розчиняли в 2 % диметилсульфоксиді/ацетоні та потім змішували з водою, що містить емульгатор, до точного об'єму для розпилення, що становить 50 мл. 50 мл цього розчину для розпилення виливали в пульверизатори для додаткових застосувань.

Для випробування попереджувальної активності сполук здорові молоді проростки/рослини рису, вирощені в теплиці, обприскували складом активної сполуки у вказаних нормах застосування всередині розпилювальних камер із використанням сопел із порожнім конусом. Через один день після обробки рослини інокулювали суспензією спор (стерильна вода), що містить $1,4 \times 10^6$ інокуляту *Pyricularia oryzae*. Інокульовані рослини потім витримували в камері теплиці за температури 24 °C і 95 % відносної вологості для прояву хвороби.

Візуальну оцінку ефективності сполук здійснювали шляхом оцінювання тяжкості хвороби (шкала 0-100 %) на прикладі оброблених рослин через 3, 7, 10 і 15 днів після застосування. Ефективність (% контролю) сполук

розраховували шляхом порівняння ступеня хвороби в оброблених рослин із таким у необробленого контролю. Оброблені рослини також оцінювали щодо сумісності рослин за допомогою реєстрації симптомів, таких як некроз, хлороз і низькорослість. Сполуки 50 51 52 54 55 94 178 180 181 277 при 500 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад В. Випробування томатів щодо *Botrytis cinera*

Сполуки розчиняли в 2 % диметилсульфоксиді/ацетоні та потім змішували з водою, що містить емульгатор, до точного об'єму для розпилення, що становить 50 мл. 50 мл цього розчину для розпилення виливали в пульверизатори для додаткових застосувань.

Для випробування попереджувальної активності сполук здорові молоді рослини квасолі/стручкового перцю, вирощені в теплиці, обприскували складом активної сполуки у вказаних нормах застосування всередині розпилювальних камер із використанням сопел із порожнім конусом. Через один день після обробки рослини інокулювали суспензією спор (2 % солоду), що містить $1,2 \times 10^6$ інокуляту *Botrytis cinerea*. Інокульовані рослини потім витримували в камері теплиці за температури 18-20 °C і 90-100 % відносної вологості для прояву хвороби.

Візуальну оцінку ефективності сполук здійснювали шляхом оцінювання тяжкості хвороби (шкала 0-100 %) на прикладі оброблених рослин через 3, 7, 10 і 15 днів після застосування. Ефективність (% контролю) сполук розраховували шляхом порівняння ступеня хвороби в обробленій рослині з таким у необробленого контролю. Оброблені рослини також оцінювали щодо сумісності рослин за допомогою реєстрації симптомів, таких як некроз, хлороз і низькорослість. Сполуки 27 36 39 45 49 192 258 263 264 269 282 при 500 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад С. Випробування сої щодо *Phakopsora pachyrhizi*

Сполуки розчиняли в 2 % диметилсульфоксиді/ацетоні та потім змішували з водою, що містить емульгатор, до точного об'єму для розпилення, що становить 50 мл. 50 мл цього розчину для розпилення виливали в пульверизатори для додаткових застосувань.

Для випробування попереджувальної активності сполук здорові молоді рослини сої, вирощені в теплиці, обприскували складом активної сполуки у вказаних нормах застосування всередині розпилювальних камер із використанням сопел із порожнім конусом. Через один день після обробки рослини інокулювали суспензією, що містить 2×10^5 *Phakopsora pachyrhizi* conidia. Інокульовані рослини потім витримували в камері теплиці за температури 22-24 °C і 80-90 % відносної вологості для прояву хвороби.

Візуальну оцінку ефективності сполук здійснювали шляхом оцінювання тяжкості хвороби (шкала 0-100 %) на прикладі оброблених рослин через 3, 7, 10 і 15 днів після застосування. Ефективність (% контролю) сполук розраховували шляхом порівняння ступеня хвороби в обробленій рослині з таким у необробленого контролю. Обпилені рослини також оцінювали щодо сумісності рослин за допомогою реєстрації симптомів, таких як некроз, хлороз і низькорослість. Сполуки 14 16 17 18 20 21 22 23 26 28 29 30 31 32 33 34 36 38 39 40 41 42 43 44 45 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 65 66 67 68 69 70 71 77 79 80 81 84 85 86 87 88 89 90 91 92 93 94 95 98 100 101 102 103 104 105 109 111 113 114 115 116 117 119 120 121 122 123 124 125 126 127 128 129 130 131 133 134 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 153 155 156 157 159 160 161 178 179 181 182 183 184 185 187 188 189 190 191 192 193 194 195 196 201 202 203 204 205 206 207 208 209 210 211 214 215 216 217 218 219 220 221 222 223 224 229 230 231 232 233 234 235 236 237 239 242 253 255 259 261 262 263 264 266 270 273 274 275 276 277 278 279 281 282 284 286 287 294 295 296 297 298 299 300 301 при 500 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

За наявності опису даного винаходу з посиланням на певні переважні аспекти фахівцю в даній галузі техніки стануть очевидними й інші аспекти з урахуванням специфікації. Для фахівців у даній галузі техніки буде очевидним, що багато модифікацій, як щодо матеріалів, так і щодо способів, можуть бути здійснені на практиці без відступу від обсягу даного винаходу.