



УКРАЇНА

(19) UA (11) 89138 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 401/00

C07D 401/14 (2008.01)

C07D 405/14 (2008.01)

C07D 409/14 (2008.01)

A01N 43/707 (2008.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) 3-(ПІРИДИН-2-ІЛ)-[1,2,4]-ТРИАЗИНИ, ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ, ЗАСІБ ДЛЯ ЗАХИСТУ РОСЛИН ТА ПОСІВНИЙ МАТЕРІАЛ

1

2

(21) а200812907

(22) 11.04.2007

(24) 25.12.2009

(86) РСТ/ЕР2007/053515, 11.04.2007

(31) 06007743.5

(32) 12.04.2006

(33) ЕР

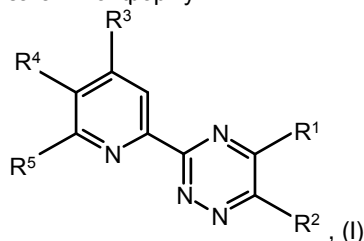
(46) 25.12.2009, Бюл.№ 24, 2009 р.

(72) ГРАММЕНОС БАССІЛІОС, GR/DE, ПРОТЕ
ТОМАС, DE, ДІТЦ ЙОХЕН, DE, ЛОМАНН ЯН КЛА-
АС, DE, РЕННЕР ЙЕНС, DE, МЮЛЛЕР БЕРНД,
DE, УЛЬМШНАЙДЕР САРА, DE

(73) БАСФ СЕ, DE

(56) ЕР 0259139 А2, 09.03.1988

US 4033752 А, 05.07.1977

(57) 1. 3-(Піридин-2-іл)-[1,2,4]-триазинові сполуки
загальної формули I

в якій:

R¹, R² незалежно один від іншого означають OH, галоген, NO₂, NH₂, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеналкіл, C₁-C₈-галогеналкокси, C₁-C₈-алкіламіно або ді(C₁-C₈-алкіл)аміно, або разом з C-атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл або гетероцикл, який поряд з членами вуглецевого кільця як кільцеві члени має один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки, причому карбоцикл і гетероцикл є незаміщеними або як замісники мають 1, 2, 3 або 4 C₁-C₄-алкільні групи;

R³ означає водень, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкокси, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкілметил або галоген;

R⁴ означає водень, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкокси або галоген;

R⁵ означає C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-галогеналкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеналкокси, C₃-C₈-циклоалкіл, C₃-C₈-циклоалкілокси, 5- або 6-членний гетероарил, феніл, фенокси, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероарилметил або 5- або 6-членний гетероарилокси, причому наведені вище циклічні залишки є незаміщеними або можуть мати 1, 2, 3, 4 або 5 залишків R^a, причому

R^a вибраний з OH, SH, галоген, NO₂, NH₂, CN, COOH, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-галогеналкіл, C₁-C₈-галогеналкокси, C₁-C₈-алкіламіно, ді(C₁-C₈-алкіл)аміно, C₁-C₈-алкілтіо, C₁-C₈-галогеналкілтіо, C₁-C₈-алкілсульфініл, C₁-C₈-галогеналкілсульфініл, C₁-C₈-алкілсульфоніл, C₁-C₈-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл, фенокси і залишків формули C(=Z)R^{aa}, в якій Z означає O, S, N(C₁-C₈-алкіл), N(C₁-C₈-алкокси), N(C₃-C₈-алкенілокси) або N(C₃-C₈-алкінілокси) і R^{aa} означає водень, C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкокси, NH₂, C₁-C₈-алкіламіно або ді(C₁-C₈-алкіл)аміно, або два приєднаних до суміжних C-атомів залишки R^a разом з C-атомами, до яких вони приєднані, також можуть утворювати насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл, бензольне кільце або 5-, 6- або 7-членний гетероцикл, який поряд з членами вуглецевого кільця як кільцеві члени має один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки, причому карбоцикл і гетероцикл є незаміщеними або як замісники мають 1, 2, 3 або 4 C₁-C₄-алкільні групи; і застосовні в сільському господарстві солі сполук формули I за винятком:

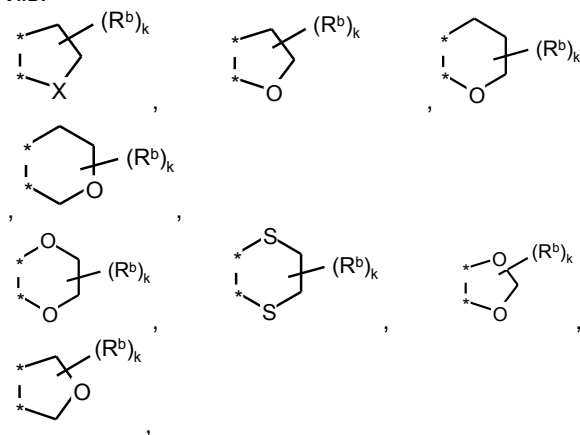
2,6-біс-(5,6-диметил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-діетил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-дипропіл-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-діізопропіл-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-дибутил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-діізобутил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-дипентил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
2,6-біс-(5,6-дигексил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,

(13) C2

(11) 89138

(19) UA

2,6-біс-(5,6-дигептил-1,2,4-триазин-3-іл)піридину,
3-[6-(2,2'-біпіридил)]-5,6-диметил-1,2,4-триазину,
3-[6-(2,2'-біпіридил)]-5,6-діетил-1,2,4-триазину,
3-[6-(2,2'-біпіридил)]-5,6-дипропіл-1,2,4-триазину,
3-[6-(2,2'-біпіридил)]-5,6-дибутил-1,2,4-триазину,
5,6-діетил-3-[6-(2-піридил)-4-метоксипіридин-2-іл]-
1,2,4-триазину,
3-(6-метилпіридин-2-іл)-5,6-диметил-1,2,4-
триазину,
3-(6-метилпіридин-2-іл)-5,6-діетил-1,2,4-триазину,
2,6-біс-(5,6-діметокси-1,2,4-триазин-3-іл)піридину і
2,6-біс-(5,6-діетокси-1,2,4-триазин-3-іл)піридину.
2. Сполуки за п. 1, які **відрізняються** тим, що R^1 і
 R^2 незалежно один від одного вибрані з фтору,
хлору, C_1 - C_4 -алкілу, метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 ,
 OCF_3 і $OCHF_2$.
3. Сполуки за п. 1, які **відрізняються** тим, що R^1 і
 R^2 разом з С-атомами триазинового циклу, до яких
вони приєднані, означають один з наступних цик-
лів:



в яких

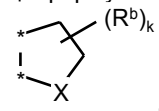
* означає атоми триазинового циклу;

k означає 0, 1, 2, 3 або 4;

R^b означає C_1 - C_4 -алкіл; і

X означає $(CH_2)_n$ з $n=1, 2$ або 3 і причому, якщо
 $k \neq 0$, то 1, 2, 3 або 4 атоми водню в $(CH_2)_n$ можуть
бути заміщені за допомогою R^b .

4. Сполуки за п. 1, які **відрізняються** тим, що R^1 і
 R^2 означають C_1 - C_4 -алкіл або разом з С-атомами
триазинового циклу, до яких вони приєднані, кіль-
це формули



в якій

* означає атоми триазинового циклу;

k означає 0, 1, 2, 3 або 4;

R^b означає C_1 - C_4 -алкіл; і

X означає $(CH_2)_n$ з $n=2$ або 3 і причому, якщо $k \neq 0$,
то 1, 2, 3 або 4 атоми водню в $(CH_2)_n$ можуть бути
заміщені за допомогою R^b .

5. Сполуки за будь-яким з попередніх пунктів, які
відрізняються тим, що R^3 означає водень, фтор,
хлор, C_1 - C_4 -алкіл, метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 ,
 OCF_3 або $OCHF_2$.

6. Сполуки за п. 5, які **відрізняються** тим, що R^3
означає водень.

7. Сполуки за п. 5, які **відрізняються** тим, що R^3
означає хлор, CF_3 , метил або метокси.

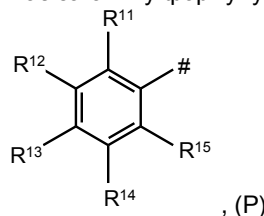
8. Сполуки за будь-яким з попередніх пунктів, які
відрізняються тим, що R^4 означає водень, фтор,
хлор, метил, етил, метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 ,
 OCF_3 або $OCHF_2$.

9. Сполуки за п. 8, які **відрізняються** тим, що R^4
означає водень, фтор, хлор або метил.

10. Сполуки за будь-яким з попередніх пунктів, які
відрізняються тим, що R^5 вибраний з галоген, C_1 -
 C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілкарбоніл, C_1 -
 C_4 -алкоксикарбоніл і залишків формули $C(=N-O-
C_1-C_8-алкіл)R^{aa}$, в якій R^{aa} означає водень або C_1 -
 C_4 -алкіл.

11. Сполуки за будь-яким з попередніх пунктів, які
відрізняються тим, що R^5 означає феніл, фенок-
си або бензил, в яких фенільний цикл має 1, 2, 3, 4
або 5 залишків R^a .

12. Сполуки за пунктом 11, які **відрізняються** тим,
що фенільний цикл в фенілі, фенокси або бензилі
має загальну формулу P



в якій $\#$ означає залишок молекули;

R^{11} означає водень, фтор, хлор, CH_3 , OCH_3 ,
 $OCHF_2$, OCF_3 або CF_3 ;

R^{12} , R^{14} незалежно один від іншого означають во-
день, хлор, фтор, CH_3 , OCH_3 , $OCHF_2$, OCF_3 або
 CF_3 , причому один з залишків R^{12} і R^{14} також може
означати NO_2 , $C(O)CH_3$ або $COOCH_3$;

R^{13} означає водень, фтор, хлор, ціано, OH , CHO ,
 NO_2 , NH_2 , метиламіно, диметиламіно, діетиламіно,
 C_1 - C_4 -алкіл, C_3 - C_8 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 -
 C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_1 - C_4 -галоалкокси,
 $CO(A^2)$, в якій A^2 означає C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -
алкокси, або групу $C(R^{13a})=NOR^{13b}$, в якій R^{13a}
означає водень або метил і R^{13b} означає C_1 - C_4 -
алкіл, пропаргіл або аліл, або R^{12} і R^{13} разом утво-
рюють групу $O-CH_2-O$; і
 R^{15} означає водень, фтор, хлор або C_1 - C_4 -алкіл.

13. Сполуки за одним з пп. 1-9, які **відрізняються**
тим, що R^5 означає C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -
галоалкіл.

14. Сполуки за одним з пп. 1-9, які **відрізняються**
тим, що R^5 вибраний з 5-членного гетероарилу,
який як атоми циклу має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту
або 1 гетероатом, вибраний з кисню і сірки, і при
необхідності 1, 2 або 3 атоми азоту, і 6-членного
гетарилу, який як кільцеві члени має 1, 2, 3 або 4
атоми азоту, причому 5- і 6-членний гетарил мо-
жуть мати 1, 2, 3 або 4 замісники R^a .

15. Сполуки за п. 14, які **відрізняються** тим, що R^5
вибраний з фурилу, тієнілу, піридинілу і піриміди-
нілу, які відповідно є незаміщеними або мають 1, 2
або 3 замісники R^a .

16. Застосування сполук формули I за одним з пп.
1-15 і їх солей для боротьби з фітопатогенними
грибами.

17. Засіб для захисту рослин, який **відрізняється** тим, що містить твердий або рідкий носій і одну сполуку формули I за одним з пп. 1-15 і/або її сіль.

18. Посівний матеріал, який **відрізняється** тим, що містить щонайменше одну сполуку формули I за одним з пп. 1-15 і/або її сіль.

19. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, який **відрізняється** тим, що гриби або матеріали, рослини, ґрунт або посівний матеріал, що підлягають захисту від ураження грибами, обробляють ефективною кількістю сполуки формули I за одним з пп. 1-15 або її сіллю.

Даний винахід відноситься до 3-(піридин-2-іл)-[1,2,4]-тріазинів і до їх застосування для боротьби зі шкідливими грибами, а також до захисту рослин, які містять подібні сполуки як діючий компонент.

Документ EP-A 234 104 описує 2-(піридин-2-іл)-піримідини, які в 6-положенні піридинового залишку мають алкільну групу і які в 3,4-положенні піримідинового циклу можуть мати анельоване насичене 5- або 6- кільце. Сполуки придатні для боротьби з фітопатогенними грибами (шкідливими грибами).

З документу US 4,873,248 відомі 2-(піридин-2-іл)-піримідини з фунгіцидною дією, які в 4-положенні піримідинового циклу при необхідності мають заміщений фенільний цикл.

Документ EP-A 259 139 описує 2-(піридин-2-іл)-піримідини, які в 6-положенні піридинового залишку при необхідності мають заміщену фенільну групу і які в 3,4-положенні піримідинового циклу можуть мати анельоване насичене 5- або 6-кільце. Сполуки рівним чином придатні для боротьби з фітопатогенними грибами (шкідливими грибами).

Заявка WO 2006/010570 описує фунгіцидно активні 2-(6-фенілпіридин-2-іл)-піримідинові сполуки наступної формули B:

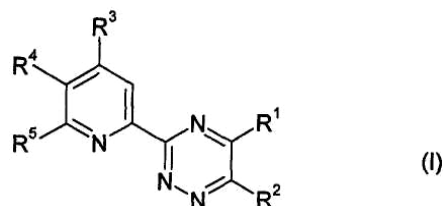


в якій: k означає 0, 1, 2 або 3, m означає 0, 1, 2, 3, 4 або 5 і n означає 1, 2, 3, 4 або 5, замісники R^a в тому числі означають галоген, OH, CN, NO_2 , C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_2 - C_4 -алкеніл, C_2 - C_4 -алкініл, C_3 - C_8 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл, аміно, фенокси, тощо, R^h означає C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, гідрокси, галоген, CN або NO_2 і R^k означає C_1 - C_4 -алкіл.

Відомі з рівня техніки 2-(піридин-2-іл)-піримідини стосовно їх фунгіцидної дії частково є незадовільними або володіють небажаними властивостями, такими як низька сумісність з технічними культурами.

Тому в основі даного винаходу лежить задача, надати нові сполуки з покращеною фунгіцидною дією і/або з покращеною сумісністю з технічними культурами.

Несподівано задача вирішується за допомогою 3-(піридин-2-іл)-[1,2,4]-тріазинових сполук загальної формули I



в якій:

R^1 , R^2 незалежно один від іншого означають OH, галоген, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_8 -алкіл, C_1 - C_8 -алкокси, C_1 - C_8 -галогеналкіл, C_1 - C_8 -галогеналкокси, C_1 - C_8 -алкіламіно або ді(C_1 - C_8 -алкіл)аміно,

або разом з C-атомами, до яких вони прив'язані, можуть утворювати насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл або гетероцикл, який поряд з членами вуглецевого кільця як кільцеві члени має один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки, причому карбоцикл і гетероцикл є незаміщеними або мають 1, 2, 3 або 4 C_1 - C_4 -алкільні групи як замісники;

R^3 означає водень, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкілметил або галоген;

R^4 означає водень, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси або галоген;

R^5 C_1 - C_8 -алкіл, C_1 - C_8 -галогеналкіл, C_1 - C_8 -алкокси, C_1 - C_8 -галогеналкокси, C_3 - C_8 -циклоалкіл, C_3 - C_8 -циклоалкілокси, 5- або 6-членний гетероарил, феніл, фенокси, бензил, бензилокси, 5- або 6-членний гетероарилметил або 5- або 6-членний гетероарилметил, причому наведені вище циклічні залишки є незаміщеними або можуть мати 1, 2, 3, 4 або 5 залишків R^a , причому

R^a вибраний з OH, SH, галоген, NO_2 , NH_2 , CN, COOH, C_1 - C_8 -алкіл, C_1 - C_8 -алкокси, C_1 - C_8 -галогеналкіл, C_1 - C_8 -галогеналкокси, C_1 - C_8 -алкіламіно, ді(C_1 - C_8 -алкіл)аміно, C_1 - C_8 -алкілтіо, C_1 - C_8 -галогеналкілтіо, C_1 - C_8 -алкілсульфініл, C_1 - C_8 -галогеналкілсульфініл, C_1 - C_8 -алкілсульфоніл, C_1 - C_8 -галогеналкілсульфоніл, C_3 - C_8 -циклоалкіл, феніл, фенокси і залишків формули $\text{C}(=\text{Z})\text{R}^{aa}$, в якій Z означає O, S, N(C_1 - C_8 -алкіл), N(C_1 - C_8 -алкокси), N(C_1 - C_8 -алкенілокси) або N(C_3 - C_8 -алкінілокси) і R^{aa} означає водень, C_1 - C_8 -алкіл, C_1 - C_8 -алкокси, NH_2 , C_1 - C_8 -алкіламіно або ді(C_1 - C_8 -алкіл)аміно, або два прив'язаних до суміжних C-атомів залишки R^a разом з C-атомами, до яких вони прив'язані, також можуть утворювати насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл, бензольне кільце або 5-, 6- або 7-членний гетероцикл, який поряд з членами вуглецевого кільця як кільцеві члени має один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки, причому

карбоцикл і гетероцикл є незаміщеними або мають 1,2,3 або 4 C₁-C₄-алкільні групи як замісники;

і застосовні в сільському господарстві солі сполук формули I.

Таким чином, об'єктом даного винаходу є 3-(піридин-2-іл)-тріазини загальної формули I і їх застосовні в сільському господарстві солі.

Далі об'єктом даного винаходу є застосування 3-(піридин-2-іл)-тріазинів загальної формули I і їх застосовних в сільському господарстві солей для боротьби з фітопатогенними грибами (= шкідливими грибами), а також спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, який відрізняється тим, що гриби, або матеріали, рослини, ґрунт або посівний матеріал, що підлягають захисту від ураження грибами обробляють ефективною кількістю сполуки загальної формули I і/або застосовною в сільському господарстві сіллю I.

Далі об'єктом даного винаходу є засіб для боротьби зі шкідливими грибами, що містить щонайменше одну 3-(піридин-2-іл)-тріазинову сполуку загальної формули I і/або її застосовну в сільському господарстві сіль і щонайменше один рідкий або твердий носій.

Сполуки формули I і їх таутомери залежно від зразка замісника можуть мати один або декілька центрів хіральності і в такому випадку представлені у вигляді чистих енантіомерів або чистих діастереомерів або у вигляді сумішей енантіомерів або діастереомерів. Об'єктом винаходу є як чисті енантіомери або діастереомери, так і їх суміші.

Серед застосовних в сільському господарстві солей, насамперед, придатні солі тих катіонів або кислотноадитивні солі тих кислот, катіони яких, відповідно аніони не послабляють фунгіцидну дію сполуки I. Таким чином, як катіони особливо придатні іони лужних металів, переважно натрію і калію, лужноземельних металів, переважно кальцію, магнію і барію, і перехідних металів, переважно марганцю, міді, цинку і заліза, а також іон амонію, який бажано може мати від одного до чотирьох C₁-C₄-алкільних замісників і/або один феніловий або бензиловий замісник, переважно діізопропіламоній, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, триметилбензиламоній, крім того, іони фосфонію, іони сульфонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфонію або іони сульфоксонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфоксонію.

Аніонами застосовних кислотноадитивних солей в першу чергу є хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідрофосфат, гідрофосфат, фосфат, нітрат, гідрокарбонат, карбонат, гексафторосилікат, гексафторфосфат, бензоат, а також аніони C₁-C₄-алканових кислот, переважно форміат, ацетат, пропіонат і бутират. Вони можуть бути утворені за допомогою реакції сполуки формули I з кислотою відповідного аніону, переважно хлористоводневою кислотою, бромисто-водневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою або азотною кислотою.

В зазначених значеннях змінних в наведених вище формулах використовуються збірні поняття, які загалом означають відповідні замісники. Значення C_n-C_m указує кожний раз можливу кількість

атомів вуглецю у відповідному заміснику або частині замісника:

галоген: фтор, хлор, бром і йод;

алкіл, а також всі апкільні частини в алкокси, апкоксиалкіл, алкілкарбоніл, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфоніл, алкілсульфініл, алкіламіно, діалкіламіно, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл: насичені, з прямим ланцюгом або розгалужені вуглеводневі залишки з від 1 до 8 (C₁-C₈-алкіл), часто від 1 до 6 (C₁-C₆-алкіл) і особливо від 1 до 4 атомами вуглецю (C₁-C₄-алкіл), такий як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутіл, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл і 1-етил-2-метилпропіл, гептил, 1-метилгексил, октил, 1-метилгептил і 2-етилгексил;

гало(ген)алкіл, а також всі галогеналкільні частини в галогеналкокси і галогеналкілтіо: з прямим ланцюгом або розгалужені алкільні групи з від 1 до 8 і особливо від 1 до 4 атомами вуглецю (як наведено вище), причому в цих групах частково або повністю атоми водню можуть бути заміщені атомами галогену як наведені вище і особливо фтором або хлором, особливо C₁-C₂-галогеналкілом, таким як хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фформметил, дифформметил, трифформметил, хлорфформметил, дихлорфформметил, хлордифформметил, 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 і 1,1,1-трифторпроп-2-іл;

алкеніл: мононенасичені, з прямим ланцюгом або розгалужені вуглеводневі залишки з від 2 до 8 або 3 до 8 атомами вуглецю і подвійним зв'язком в будь-якому положенні, наприклад, 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;

алкініл: з прямим ланцюгом або розгалужені вуглеводневі групи з від 2 до 8 або 3 до 8 атомами вуглецю і потрійним зв'язком в будь-якому положенні, наприклад, етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл;

циклоалкіл: моноциклічні, насичені вуглеводневі групи з від 3 до 8, переважно до 6 вуглецевими кільцевими членами, такими як циклопропіл, циклобутил, циклопентил і циклогексил;

циклоалкілметил: циклоалкільний залишок, як наведений вище, який зв'язаний за допомогою метиленової групи (CH₂).

алкіламіно, а також алкіламіно частини в алкіламінокарбонілі: зв'язану за допомогою NH-групи алкільну групу, в якій алкіл означає один з зазначених вище алкільних залишків з від 1 до 8 C-атомами, такими як метиламіно, етиламіно, n-

пропіламіно, ізопропіл аміно, n-бутиламіно і тому подібні;

діалкіламіно, а також діалкіламіно частини в діалкіламінокарбонілі: залишок формули $N(\text{алкіл})_2$, в якій алкіл означає один з зазначених вище алкільних залишків з від 1 до 8 С-атомами, наприклад, диметиламіно, діетиламіно, метилетиламіно, N-метил-N-пропіламіно і тому подібні;

алкокси, а також алкокси частини в алкоксикарбонілі: зв'язану киснем алкілну групу з від 1 до 8, особливо 1 до 6 і особливо від 1 до 4 С-атомами, наприклад, метокси, етокси, n-пропокси, 1-метилетокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси або 1,1-диметилетокси;

алкоксикарбоніл: зв'язаний карбонільною групою алкокси залишок, як наведений вище;

алкілтіо: зв'язана атомом сірки алкільна група, як наведена вище;

алкілсульфініл: зв'язану за допомогою $S(=O)$ -групи алкілну групу, як наведено вище;

алкілсульфоніл: зв'язану за допомогою $S(=O)_2$ -групи алкілну групу, як наведено вище;

галогеналкокси: алкокси залишок з від 1 до 8, особливо 1 до 6 і особливо від 1 до 4 С-атомами, як наведено вище, який частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, переважно фтором, отже, наприклад, OCH_2F , $OCHF_2$, OCF_3 , OCH_2Cl , $OCHCl_2$, $OSCl_3$, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 2-фторетокси, 2-хлоретокси, 2-брометокси, 2-йодетокси, 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, OC_2F_5 , 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 2-бромпропокси, 3-бромпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси, $OCH_2-C_2F_5$, $OCF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-фторетокси, 1-(CH_2Cl)-2-хлоретокси, 1-(CH_2Br)-2-брометокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси або нонафторбутокси;

алкілен: лінійні насичені вуглеводневі ланцюги з від 2 до 6 і особливо від 2 до 4 С-атомами, такими як етан-1,2-дііл, пропан-1,3-дііл, бутан-1,4-дііл, пентан-1,5-дііл або гексан-1,6-дііл.

Насичений 5-, 6- або 7-членний гетероцикл, що має як кільцеві члени один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки: цикл, який складається з атомів вуглецю і 1 або 2 гетероатомів, вибраних з сірки і кисню, причому загальне число атомів циклу (кільцевих членів) становить 5, 6 або 7, наприклад: оксолан, оксепан, океан (тетрагідропіран), 1,3-діоксолан, 1,3-діоксан, 1,4-діоксан, тіолан, тіан, тіепан, 1,3-дитіолан, 1,3-дитіан і 1,4-дитіан;

5- або 6-членний гетероарил: 5- або 6-членний ароматичний цикл, який поряд з вуглецем як кільцеві члени має 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, причому гетероатоми типово вибрані з кисню, азоту і сірки, особливо:

- 5-членний гетероарил, який має 1, 2, 3 або 4 атомів азоту як кільцеві члени, такі як 1-, 2- або 3-піроліл, 1-, 3- або 4-піразоліл, 1-, 2- або 4-імідазоліл, 1,2,3-[1H]-тріазол-1-іл, 1,2,3-[2H]-

тріазол-2-іл, 1,2,3-[1H]-тріазол-4-іл, 1,2,3-[1H]-тріазол-5-іл, 1,2,3-[2H]-тріазол-4-іл, 1,2,4-[1H]-тріазол-1-іл, 1,2,4-[1H]-тріазол-3-іл, 1,2,4-[1H]-тріазол-5-іл, 1,2,4-[4H]-тріазол-4-іл, 1,2,4-[4H]-тріазол-3-іл, [1H]-тетразол-1-іл, [1H]-тетразол-5-іл, [2H]-тетразол-2-іл і [2H]-тетразол-5-іл;

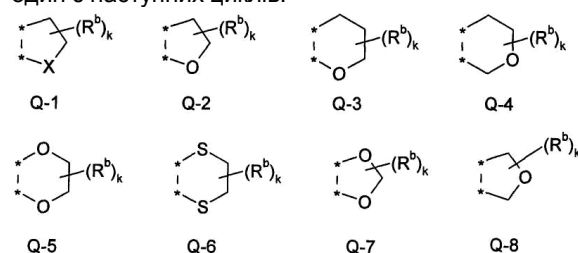
- 5-членний гетероарил, який 1 як кільцеві члени має гетероатоми, вибрані з кисню і сірки і при необхідності 1, 2 або 3 атомів азоту, наприклад, 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 3- або 4-ізоксазоліл, 3- або 4-ізотіазоліл, 2-, 4- або 5-оксазоліл, 2-, 4- або 5-тіазоліл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-5-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл і 1,3,4-оксадіазол-2-іл;

- 6-членний гетероарил, який має 1, 2, 3 або 4 атомів азоту як кільцеві члени, таких як 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 1,2,4-тріазин-3-іл, 1,2,4-тріазин-5-іл, 1,2,4-тріазин-6-іл і 1,3,5-тріазиніл.

Беручи до уваги застосування як фунгіцидів переважними є ті сполуки формули I, в якій змінні R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і R^5 незалежно одна від іншої і, особливо в комбінації мають наступні значення:

Відповідно до першої форми здійснення винаходу R^1 і R^2 незалежно один від іншого означають одновалентні залишки. R^1 і R^2 можуть при цьому бути однаковими або різними. В такому випадку вони переважно вибрані з фтору, хлору, C_1 - C_4 -алкілу, особливо метилу, етилу або n-пропілу, далі метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 і $OCHF_2$.

Відповідно до другої форми здійснення винаходу R^1 і R^2 разом з С-атомами, до яких вони прив'язані, утворюють насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл або гетероцикл, такий як визначений вище, і може мати одну або декілька C_1 - C_4 -алкільних груп як замісники. В цій формі здійснення R^1 і R^2 разом з С-атомами тріазинового циклу, до яких вони прив'язані, переважно означають один з наступних циклів:



в яких

* означає атоми тріазинового циклу;

k означає 0, 1, 2, 3 або 4;

R^b означає C_1 - C_4 -алкіл, особливо метил; і

X означає $(CH_2)_n$ з n = 1, 2 або 3.

Залишки R^b можуть бути розташовані у будь-яких атомів вуглецю цих циклів і, наприклад, якщо $k \neq 0$, то 1, 2, 3 або 4 атоми водню в $(CH_2)_n$ можуть бути заміщені за допомогою R^b . Орієнтація залишків Q-2, Q-3 і Q-4 відносно тріазинового циклу є довільною. Серед залишків від Q-1 до Q-8 особливо переважним є залишок Q-1 і особливо залишок Q-1 з n=2 або 3. Змінна k особливо означає 0, 1 або 2.

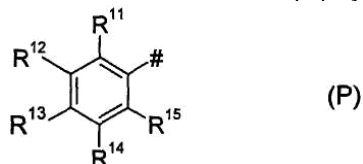
R^3 переважно означає водень, фтор, хлор, C_1 - C_4 -алкіл, особливо метил, етил, ізопропіл або трет.-бутил, метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 або $OCHF_2$, особливо водень або метил. Далі особливо переважними є сполуки формули I, в якій R^3 означає хлор. Далі особливо переважними є сполуки формули I, в якій R^3 означає CF_3 . Далі особливо переважними є сполуки формули I, в якій R^3 означає метокси або етокси.

R^4 переважно означає водень, фтор, хлор, C_1 - C_4 -алкіл, особливо метил або етил, метокси, етокси, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 або $OCHF_2$. Особливо R^4 означає водень, фтор, хлор або метил.

В переважних сполуках формули I R^5 означає феніл, фенокси або бензил, причому фенільний цикл в трьох зазначених вище залишках є незаміщеним або має 1, 2, 3, 4 або 5 залишків R^a , особливо 1, 2 або 3 залишки R^a .

Переважні залишки R^a вибрані з галогену, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_2 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_2 -галогеналкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілкарбоніл, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, і залишків формули $C(=N-O-C_1-C_8\text{-алкіл})R^{aa}$, в якій R^{aa} означає водень або C_1 - C_4 -алкіл. Особливо переважними є залишки R^a , вибрані з галогену, особливо хлор або фтор, метил, метокси, трифторметил, дифторметил, трифторметокси, дифторметокси і метилтіо.

Згідно з однією переважною формою здійснення винаходу R^5 в формулі I означає феніл, фенокси або бензил, в якій фенільний цикл має 1, 2, 3, 4 або 5 і особливо 1, 2 або 3 залишки R^a , причому залишки R^a переважно вибрані з названих переважними залишків R^a і особливо з названих як особливо переважні залишків R^a . В цій формі здійснення фенільний залишок в феніл, фенокси або бензил означає залишок формули P:



в якій # є місцем сполучення з піридиновим циклом і R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} і R^{15} означають водень або щонайменше один з цих залишків, наприклад, 1, 2, 3, 4 або 5 цих залишків мають значення, зазначене для R^a , особливо зазначені як переважні або особливо переважні значення. В одній переважній формі здійснення, щонайменше, один і особливо 1, 2 або 3 залишки R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} або R^{15} відрізняються від водню. Особливо означають:

R^{11} водень, фтор, хлор, CH_3 , OCH_3 , $OCHF_2$, OCF_3 або CF_3 ;

R^{12} , R^{14} незалежно один від іншого водень, хлор, фтор, CH_3 , OCH_3 , $OCHF_2$, OCF_3 або CF_3 , причому один з залишків R^{12} і R^{14} також може означати NO_2 , $C(O)CH_3$ або $COOCH_3$; особливо R^{12} і R^{14} означають водень, фтор, метил або трифторметил;

R^{13} водень, фтор, хлор, ціано, OH, CHO, NO_2 , NH_2 , метиламіно, диметиламіно, діетиламіно, C_1 - C_4 -алкіл, особливо CH_3 , C_2H_5 , $CH(CH_3)_2$, C_3 - C_8 -циклоалкіл, особливо циклопропіл, цикlopентил або циклогексил, C_1 - C_4 -алкокси, особливо OCH_3 ,

C_1 - C_4 -алкілтіо, особливо метилтіо або етилтіо, C_1 - C_4 -галоалкіл, особливо CF_3 , C_1 - C_4 -галоалкокси, особливо $OCHF_2$ або OCF_3 , або $CO(A^2)$, в якій A^2 означає C_1 - C_4 -алкіл, особливо метил або C_1 - C_4 -алкокси, особливо OCH_3 , або групу $C(R^{13a})=NOR^{13b}$, в якій R^{13a} означає водень або метил і R^{13b} означає C_1 - C_4 -алкіл, пропаргіл або алліл, або R^{12} і R^{13} разом утворюють групу $O-CH_2-O$; і

R^{15} водень, фтор, хлор, або C_1 - C_4 -алкіл, особливо CH_3 , особливо водень або фтор.

Якщо більше, ніж один з залишків R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} або R^{15} відрізняється від водню, тоді вигідно тільки один з залишків, що відрізняється від водню, відрізняється від галогену або метилу. Особливо якщо один з залишків R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} або R^{15} відрізняється від водню, галогену або метилу, тоді залишки R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , що залишилися, вибрані з галогену і водню.

Прикладами залишків P є наведені в подальшому залишки: феніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-трифторметилфеніл, 3-трифторметилфеніл, 4-трифторметилфеніл, 2-(метилтіо)феніл, 3-(метилтіо)феніл, 4-(метилтіо)феніл, 2-метоксифеніл, 3-метоксифеніл, 4-метоксифеніл, 4-нітрофеніл, 4-ціанофеніл, 4-трет.-бутилфеніл, 4-ізопропіл феніл, 3-етоксифеніл, 4-етоксифеніл, 4-n-пропоксифеніл, 4-ізопропоксифеніл, 3-ізопропоксифеніл, 4-n-бутоксифеніл, 4-трет.-бутоксифеніл, 4-ацетилфеніл, 4-метоксикарбонілфеніл, 4-етоксикарбонілфеніл, 4-трет.-бутоксикарбонілфеніл, 4-(метоксиімінометил)феніл, 4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,5-дифторфеніл, 3,4-дифторфеніл, 3,5-дифторфеніл, 2,6-дифторфеніл, 2,4,6-трифторфеніл, 2,4,5-трифторфеніл, 2,3,4-трифторфеніл, 2,3,5-трифторфеніл, 3,4,5-трифторфеніл, 2,3-дихлорфеніл, 2,5-дихлорфеніл, 3,5-дихлорфеніл, 2,6-дихлорфеніл, 2,3-диметилфеніл, 2,4-диметилфеніл, 2,5-диметилфеніл, 2,4,5-триметилфеніл, 2,3-диметоксифеніл, 2,4-диметоксифеніл, 3,4-диметоксифеніл, 2,4-біс(трифторметил)феніл, 3,5-біс(трифторметил)феніл, 2-метил-3-метоксифеніл, 2-метил-4-метоксифеніл, 2-метил-6-метоксифеніл, 3-хлор-4-фторфеніл, 2-хлор-4-фторфеніл, 2-хлор-6-фторфеніл, 4-хлор-2-фторфеніл, 5-хлор-2-фторфеніл, 4-фтор-3-метилфеніл, 2-фтор-4-метилфеніл, 4-фтор-2-метилфеніл, 2-фтор-3-метоксифеніл, 2-фтор-4-метоксифеніл, 2-фтор-6-метоксифеніл, 2-фтор-4-трифторметилфеніл, 4-хлор-3-метилфеніл, 2-хлор-4-метилфеніл, 2-хлор-6-метилфеніл, 3-хлор-2-метилфеніл, 5-хлор-2-метилфеніл, 2-хлор-4-метоксифеніл, 2-хлор-6-метоксифеніл, 2-хлор-4-трифторметилфеніл, 3-фтор-4-метилфеніл, 4-фтор-3-метилфеніл, 3-фтор-4-метоксифеніл, 3-фтор-4-етоксифеніл, 3-фтор-4-трифторметилфеніл, 3-хлор-4-метилфеніл, 3-хлор-4-метоксифеніл, 3-хлор-4-етоксифеніл, 3-хлор-4-трифторметилфеніл, 3-метил-4-метоксифеніл, 4-хлор-2,5-дифторфеніл, 4-трет.-бутил-2-фторфеніл, 2-фтор-4-ізопропілфеніл, 4-

етокси-2-фторфеніл, 4-ацетил-2-фторфеніл, 2-метилфеніл, 3-метилфеніл, 4-метилфеніл, 2-етилфеніл, 3-етилфеніл, 4-етилфеніл.

Особливо переважно R^5 в формулі I означає феніл і особливо залишок P і особливо один з наведених тут як приклад залишків P.

Відповідно до іншої переважної форми здійснення R^5 означає C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галоалкіл, особливо C_1 - C_6 -алкіл, особливо n-пропіл, ізопропіл, трет.-бутил, 1,2-диметилпропіл або 1,2,2-триметилпропіл, або трифторметил.

Відповідно до іншої переважної форми здійснення R^5 означає 5-членний гетероарил, який поряд з вуглецем має 1,2,3 або 4 атоми азоту як атоми циклу; або 5-членний гетероарил, який поряд з вуглецем як атоми циклу має 1 гетероатом, вибраний з кисню і сірки і при необхідності 1, 2 або 3 атоми азоту, або 6-членний гетарил, який як атоми циклу має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту, причому 5- і 6-членний гетарил може бути незаміщеним або атоми водню в незаміщеному гетарилі частково або повністю можуть бути заміщені замісником R^a зазначеного вище виду, так що загальне число всіх замісників R^a у гетарила типово становить 1, 2, 3 або 4. Замісниками у азотних атомів циклу особливо є C-зв'язані залишки R^a і особливо C_1 - C_4 -алкіл.

В цій формі здійснення R^5 переважно означає при необхідності заміщений 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піридил, 3-піридил, 4-піридил, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл або 5-піримідиніл, причому зазначені вище гетероциклічні залишки переважно є незаміщеними або мають 1, 2 або 3 замісника R^a . Сказане вище відноситься до переважних і особливо переважних залишків.

Прикладами переважних гетероароматичних залишків R^5 є

- при необхідності заміщений 2-тієніл, такий як незаміщений 2-тієніл, 5-метилтіофен-2-іл, 4-метилтіофен-2-іл, 5-хлортіофен-2-іл, 3-ціанотіофен-2-іл, 5-формілтіофен-2-іл, 5-ацетилтіофен-2-іл, 5-(метоксиімінометил)тіофен-2-іл, 5-(1-(метоксиіміно)етил)тіофен-2-іл, 4-бромтіофен-2-іл, 3,5-дихлортіофен-2-іл,

- при необхідності заміщений 3-тієніл, такий як незаміщений 3-тієніл, 2-метилтіофен-3-іл, 2,5-дихлортіофен-3-іл, 2,4,5-трихлортіофен-3-іл,

- при необхідності заміщений 2-фурил, такий як незаміщений 2-фурил, 5-метилфуран-2-іл, 5-хлорфуран-2-іл, 4-метилфуран-2-іл, 3-ціанофуран-2-іл, 5-ацетилфуран-2-іл,

- при необхідності заміщений 3-фурил, такий як незаміщений 3-фурил, 2-метилфуран-3-іл, 2,5-диметилфуран-3-іл,

- при необхідності заміщений 2-піридил, такий як незаміщений 2-піридил, 3-фтор-піридин-2-іл, 3-хлор-піридин-2-іл, 3-бромпіридин-2-іл, 3-трифторметил-піридин-2-іл, 3-метил-піридин-2-іл, 3-етил-піридин-2-іл, 3,5-дифтор-піридин-2-іл, 3,5-дихлор-піридин-2-іл, 3,5-дибром-піридин-2-іл, 3,5-диметил-піридин-2-іл, 3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл, 3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл, 3-хлор-5-метил-піридин-2-іл, 3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл, 3-фтор-5-метил-піридин-2-іл, 3-метил-5-фтор-піридин-2-іл, 3-метил-5-хлор-піридин-2-іл, 5-нітро-

піридин-2-іл, 5-ціано-піридин-2-іл, 5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл, 5-трифторметил-піридин-2-іл, 5-метил-піридин-2-іл, 4-метил-піридин-2-іл, 6-метил-піридин-2-іл,

- при необхідності заміщений 3-піридил, такий як незаміщений 3-піридил, 2-хлор-піридин-3-іл, 2-бром-піридин-3-іл, 2-метил-піридин-3-іл, 2,4-дихлор-піридин-3-іл, 2,4-дибром-піридин-3-іл, 2,4-дифторпіридин-3-іл, 2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл, 2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл, 2-хлор-4-метил-піридин-3-іл, 2-метил-4-фтор-піридин-3-іл, 2-метил-4-хлор-піридин-3-іл, 2,4-диметил-піридин-3-іл, 2,4,6-трихлорпіридин-3-іл, 2,4,6-трибромпіридин-3-іл, 2,4,6-триметил-піридин-3-іл, 2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл, 6-метоксипіридин-3-іл, 6-хлорпіридин-3-іл,

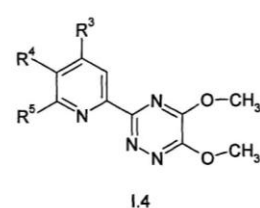
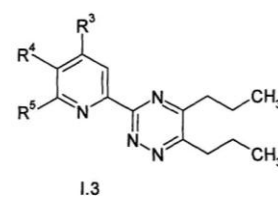
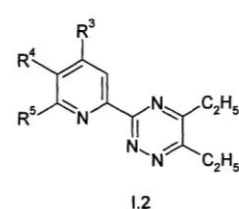
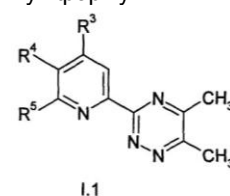
- при необхідності заміщений 4-піридил, такий як незаміщений 4-піридил, 3-хлор-піридин-4-іл, 3-бром-піридин-4-іл, 3-метил-піридин-4-іл, 3,5-дихлор-піридин-4-іл, 3,5-дибром-піридин-4-іл, 3,5-диметил-піридин-4-іл,

- при необхідності заміщений 4-піримідиніл, такий як незаміщений 4-піримідиніл, 5-хлорпіримідин-4-іл, 5-фторпіримідин-4-іл, 5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл, 2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 6-трифторметил-піримідин-4-іл, 2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл, 2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл, 5-бром-6-метил-піримідин-4-іл, 5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл, 5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл, 2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл, 5,6-диметил-піримідин-4-іл, 2,5-диметил-піримідин-4-іл, 2,5,6-триметил-піримідин-4-іл, 5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл,

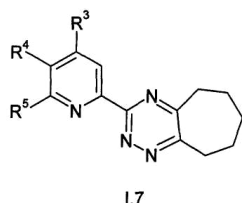
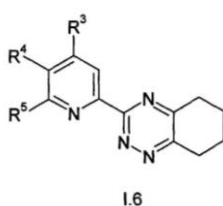
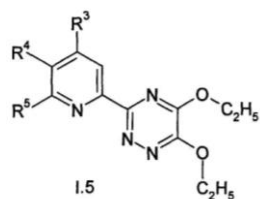
- при необхідності заміщений 5-піримідиніл, такий як незаміщений 5-піримідиніл, 4-метил-піримідин-5-іл, 4,6-диметил-піримідин-5-іл, 2,4,6-триметилпіримідин-5-іл, 4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл,

- при необхідності заміщений 2-піримідиніл, такий як незаміщений 2-піримідиніл, 4,6-диметилпіримідин-2-іл, 4,5,6-триметилпіримідин-2-іл, 4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл і 4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл.

Особливо переважними є наступні групи сполук формули I:



Таблиця А



Особливо, враховуючи їх застосування, переважними є названі в нижченаведених таблицях від 1 до 9 сполуки загальних формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7.

Таблиця 1

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає водень і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 2

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає метил і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 3

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає етил і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 4

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає метокси і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 5

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає етоксиди і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 6

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7 в яких R³ означає ізо-пропіл і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 7

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає трет.-бутил і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 8

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7 в яких R³ означає трифторметил і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

Таблиця 9

сполуки формул I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 і I.7, в яких R³ означає диформетокси і комбінація з R⁴ і R⁵ кожного разу відповідає сполуці одного рядка таблиці А.

№	R ⁴	R ⁵
A-1.	H	феніл
A-2.	H	2-фторфеніл
A-3.	H	3-фторфеніл
A-4.	H	4-фторфеніл
A-5.	H	2-хлорфеніл
A-6.	H	3-хлорфеніл
A-7.	H	4-хлорфеніл
A-8.	H	3-бромфеніл
A-9.	H	4-бромфеніл
A-10.	H	2-трифторметилфеніл
A-11.	H	3-трифторметилфеніл
A-12.	H	4-трифторметилфеніл
A-13.	H	2-(метилтіо)феніл
A-14.	H	3-(метилтіо)феніл
A-15.	H	4-(метилтіо)феніл
A-16.	H	2-метоксифеніл
A-17.	H	3-метоксифеніл
A-18.	H	4-метоксифеніл
A-19.	H	4-нітрофеніл
A-20.	H	4-ціанофеніл
A-21.	H	4-трет.-бутилфеніл
A-22.	H	4-ізопропілфеніл
A-23.	H	3-етоксифеніл
A-24.	H	4-етоксифеніл
A-25.	H	4-п-пропоксифеніл
A-26.	H	3-ізопропоксифеніл
A-27.	H	4-ізопропоксифеніл
A-28.	H	4-п-бутоксифеніл
A-29.	H	4-трет.-бутоксифеніл
A-30.	H	4-(метоксиімінометил)феніл
A-31.	H	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-32.	H	2,3-дифторфеніл
A-33.	H	2,4-дифторфеніл
A-34.	H	2,5-дифторфеніл
A-35.	H	3,4-дифторфеніл
A-36.	H	3,5-дифторфеніл
A-37.	H	2,6-дифторфеніл
A-38.	H	2,4,6-трифторфеніл
A-39.	H	2,4,5-трифторфеніл
A-40.	H	2,3,4-трифторфеніл
A-41.	H	2,3,5-трифторфеніл
A-42.	H	3,4,5-трифторфеніл
A-43.	H	2,3-дихлорфеніл
A-44.	H	2,5-дихлорфеніл
A-45.	H	3,5-дихлорфеніл
A-46.	H	2,6-дихлорфеніл
A-47.	H	2,3-диметилфеніл
A-48.	H	2,4-диметилфеніл
A-49.	H	2,5-диметилфеніл
A-50.	H	2,4,5-триметилфеніл
A-51.	H	2,3-диметоксифеніл
A-52.	H	2,4-диметоксифеніл
A-53.	H	3,4-диметоксифеніл
A-54.	H	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-55.	H	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-56.	H	2-метил-3-метоксифеніл
A-57.	H	2-метил-4-метоксифеніл
A-58.	H	2-метил-6-метоксифеніл
A-59.	H	3-хлор-4-фторфеніл

A-60.	H	2-хлор-4-фторфеніл
A-61.	H	2-хлор-6-фторфеніл
A-62.	H	4-хлор-2-фторфеніл
A-63.	H	5-хлор-2-фторфеніл
A-64.	H	4-фтор-3-метилфеніл
A-65.	H	2-фтор-4-метилфеніл
A-66.	H	4-фтор-2-метилфеніл
A-67.	H	2-фтор-3-метоксифеніл
A-68.	H	2-фтор-4-метоксифеніл
A-69.	H	2-фтор-6-метоксифеніл
A-70.	H	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-71.	H	4-хлор-3-метилфеніл
A-72.	H	2-хлор-4-метилфеніл
A-73.	H	2-хлор-6-метилфеніл
A-74.	H	5-хлор-2-метилфеніл
A-75.	H	3-хлор-2-метилфеніл
A-76.	H	2-хлор-4-метоксифеніл
A-77.	H	2-хлор-6-метоксифеніл
A-78.	H	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-79.	H	3-фтор-4-метилфеніл
A-80.	H	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-81.	H	4-фтор-3-метилфеніл
A-82.	H	3-фтор-4-метоксифеніл
A-83.	H	3-фтор-4-етоксифеніл
A-84.	H	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-85.	H	3-хлор-4-метилфеніл
A-86.	H	3-хлор-4-метоксифеніл
A-87.	H	3-хлор-4-етоксифеніл
A-88.	H	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-89.	H	3-метил-4-метоксифеніл
A-90.	H	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-91.	H	4-трет.-бутил-2-фторфеніл
A-92.	H	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-93.	H	4-етокси-2-фторфеніл
A-94.	H	4-ацетил-2-фторфеніл
A-95.	H	2-тієніл
A-96.	H	5-метилтіофен-2-іл
A-97.	H	4-метилтіофен-2-іл
A-98.	H	5-хлортіофен-2-іл
A-99.	H	3-ціанотіофен-2-іл
A-100.	H	5-формілтіофен-2-іл
A-101.	H	5-ацетилтіофен-2-іл
A-102.	H	5-(метоксиімінометил)тіофен-2-іл
A-103.	H	5-(1-(метоксиіміно)етил)тіофен-2-іл
A-104.	H	4-бромтіофен-2-іл
A-105.	H	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-106.	H	3-тієніл
A-107.	H	2-метилтіофен-3-іл
A-108.	H	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-109.	H	2,4,5-трихлор-тіофен-3-іл
A-110.	H	2-фурил
A-111.	H	5-метилфуран-2-іл
A-112.	H	5-хлорфуран-2-іл
A-113.	H	4-метилфуран-2-іл
A-114.	H	3-ціанофуран-2-іл
A-115.	H	5-ацетилфуран-2-іл
A-116.	H	3-фурил
A-117.	H	2-метилфуран-3-іл
A-118.	H	2,5-диметилфуран-3-іл
A-119.	H	2-піридил

A-120.	H	3-фтор-піридин-2-іл
A-121.	H	3-хлор-піридин-2-іл
A-122.	H	3-бромпіридин-2-іл
A-123.	H	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-124.	H	3-метил-піридин-2-іл
A-125.	H	3-етил-піридин-2-іл
A-126.	H	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-127.	H	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-128.	H	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-129.	H	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-130.	H	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-131.	H	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-132.	H	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-133.	H	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-134.	H	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-135.	H	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-136.	H	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-137.	H	5-нітро-піридин-2-іл
A-138.	H	5-ціано-піридин-2-іл
A-139.	H	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-140.	H	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-141.	H	5-метил-піридин-2-іл
A-142.	H	4-метил-піридин-2-іл
A-143.	H	6-метил-піридин-2-іл
A-144.	H	3-піридил
A-145.	H	2-хлор-піридин-3-іл
A-146.	H	2-бром-піридин-3-іл
A-147.	H	2-метил-піридин-3-іл
A-148.	H	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-149.	H	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-150.	H	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-151.	H	2-фтор-4-хлорпіриди н-3-іл
A-152.	H	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-153.	H	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-154.	H	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-155.	H	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-156.	H	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-157.	H	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-158.	H	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-159.	H	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-160.	H	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-161.	H	4-піридил
A-162.	H	3-хлор-піридин-4-іл
A-163.	H	3-бром-піридин-4-іл
A-164.	H	3-метил-піридин-4-іл
A-165.	H	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-166.	H	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-167.	H	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-168.	H	4-піримідиніл
A-169.	H	5-хлорпіримідин-4-іл
A-170.	H	5-фторпіримідин-4-іл
A-171.	H	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-172.	H	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-173.	H	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-174.	H	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-175.	H	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-176.	H	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-177.	H	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл

A-178.	H	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-179.	H	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-180.	H	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-181.	H	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-182.	H	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-183.	H	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-184.	H	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-185.	H	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-186.	H	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-187.	H	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-188.	H	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-189.	H	5-піримідиніл
A-190.	H	4-метил-піримідин-5-іл
A-191.	H	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-192.	H	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-193.	H	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-194.	H	2-піримідиніл
A-195.	H	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-196.	H	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-197.	H	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-198.	H	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-199.	CH ₃	феніл
A-200.	CH ₃	2-фторфеніл
A-201.	CH ₃	3-фторфеніл
A-202.	CH ₃	4-фторфеніл
A-203.	CH ₃	2-хлорфеніл
A-204.	CH ₃	3-хлорфеніл
A-205.	CH ₃	4-хлорфеніл
A-206.	CH ₃	3-бромфеніл
A-207.	CH ₃	4-бромфеніл
A-208.	CH ₃	2-трифторметилфеніл
A-209.	CH ₃	3-трифторметилфеніл
A-210.	CH ₃	4-трифторметилфеніл
A-211.	CH ₃	2-(метилтіо)феніл
A-212.	CH ₃	3-(метилтіо)феніл
A-213.	CH ₃	4-(метилтіо)феніл
A-214.	CH ₃	2-метоксифеніл
A-215.	CH ₃	3-метоксифеніл
A-216.	CH ₃	4-метоксифеніл
A-217.	CH ₃	4-нітрофеніл
A-218.	CH ₃	4-ціанофеніл
A-219.	CH ₃	4-трет.-бутилфеніл
A-220.	CH ₃	4-ізопропілфеніл
A-221.	CH ₃	3-етоксифеніл
A-222.	CH ₃	4-етоксифеніл
A-223.	CH ₃	4-п-пропоксифеніл
A-224.	CH ₃	3-ізопропоксифеніл
A-225.	CH ₃	4-ізопропоксифеніл
A-226.	CH ₃	4-п-бутоксифеніл
A-227.	CH ₃	4-трет.-бутоксифеніл
A-228.	CH ₃	4-(метоксиімінометил)феніл
A-229.	CH ₃	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-230.	CH ₃	2,3-дифторфеніл
A-231.	CH ₃	2,4-дифторфеніл
A-232.	CH ₃	2,5-дифторфеніл

A-233.	CH ₃	3,4-дифторфеніл
A-234.	CH ₃	3,5-дифторфеніл
A-235.	CH ₃	2,6-дифторфеніл
A-236.	CH ₃	2,4,6-трифторфеніл
A-237.	CH ₃	2,4,5-трифторфеніл
A-238.	CH ₃	2,3,4-трифторфеніл
A-239.	CH ₃	2,3,5-трифторфеніл
A-240.	CH ₃	3,4,5-трифторфеніл
A-241.	CH ₃	2,3-дихлорфеніл
A-242.	CH ₃	2,5-дихлорфеніл
A-243.	CH ₃	3,5-дихлорфеніл
A-244.	CH ₃	2,6-дихлорфеніл
A-245.	CH ₃	2,3-диметилфеніл
A-246.	CH ₃	2,4-диметилфеніл
A-247.	CH ₃	2,5-диметилфеніл
A-248.	CH ₃	2,4,5-триметилфеніл
A-249.	CH ₃	2,3-диметоксифеніл
A-250.	CH ₃	2,4-диметоксифеніл
A-251.	CH ₃	3,4-диметоксифеніл
A-252.	CH ₃	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-253.	CH ₃	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-254.	CH ₃	2-метил-3-метоксифеніл
A-255.	CH ₃	2-метил-4-метоксифеніл
A-256.	CH ₃	2-метил-6-метоксифеніл
A-257.	CH ₃	3-хлор-4-фторфеніл
A-258.	CH ₃	2-хлор-4-фторфеніл
A-259.	CH ₃	2-хлор-6-фторфеніл
A-260.	CH ₃	4-хлор-2-фторфеніл
A-261.	CH ₃	5-хлор-2-фторфеніл
A-262.	CH ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-263.	CH ₃	2-фтор-4-метилфеніл
A-264.	CH ₃	4-фтор-2-метилфеніл
A-265.	CH ₃	2-фтор-3-метоксифеніл
A-266.	CH ₃	2-фтор-4-метоксифеніл
A-267.	CH ₃	2-фтор-6-метоксифеніл
A-268.	CH ₃	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-269.	CH ₃	4-хлор-3-метилфеніл
A-270.	CH ₃	2-хлор-4-метилфеніл
A-271.	CH ₃	2-хлор-6-метилфеніл
A-272.	CH ₃	5-хлор-2-метилфеніл
A-273.	CH ₃	3-хлор-2-метилфеніл
A-274.	CH ₃	2-хлор-4-метоксифеніл
A-275.	CH ₃	2-хлор-6-метоксифеніл
A-276.	CH ₃	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-277.	CH ₃	3-фтор-4-метилфеніл
A-278.	CH ₃	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-279.	CH ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-280.	CH ₃	3-фтор-4-метоксифеніл
A-281.	CH ₃	3-фтор-4-етоксифеніл
A-282.	CH ₃	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-283.	CH ₃	3-хлор-4-метилфеніл
A-284.	CH ₃	3-хлор-4-метоксифеніл
A-285.	CH ₃	3-хлор-4-етоксифеніл
A-286.	CH ₃	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-287.	CH ₃	3-метил-4-метоксифеніл
A-288.	CH ₃	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-289.	CH ₃	4-трет.-бутил-2-фторфеніл
A-290.	CH ₃	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-291.	CH ₃	4-етокси-2-фторфеніл
A-292.	CH ₃	4-ацетил-2-фторфеніл
A-293.	CH ₃	2-тіеніл
A-294.	CH ₃	5-метилтіофен-2-іл

A-295.	CH ₃	4-метилтіофен-2-іл
A-296.	CH ₃	5-хлортіофен-2-іл
A-297.	CH ₃	3-ціанотіофен-2-іл
A-298.	CH ₃	5-формілітіофен-2-іл
A-299.	CH ₃	5-ацетилтіофен-2-іл
A-300.	CH ₃	5-(метоксиімінометил)тіофен-2-іл
A-301.	CH ₃	5-(1-(метоксиіміно)етил)тіофен-2-іл
A-302.	CH ₃	4-бромтіофен-2-іл
A-303.	CH ₃	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-304.	CH ₃	3-тієніл
A-305.	CH ₃	2-метилтіофен-3-іл
A-306.	CH ₃	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-307.	CH ₃	2,4,5-трихлор-тіофен-3-іл
A-308.	CH ₃	2-фурил
A-309.	CH ₃	5-метилфуран-2-іл
A-310.	CH ₃	5-хлорфуран-2-іл
A-311.	CH ₃	4-метилфуран-2-іл
A-312.	CH ₃	3-ціанофуран-2-іл
A-313.	CH ₃	5-ацетилфуран-2-іл
A-314.	CH ₃	3-фурил
A-315.	CH ₃	2-метилфуран-3-іл
A-316.	CH ₃	2,5-диметилфуран-3-іл
A-317.	CH ₃	2-піридил
A-318.	CH ₃	3-фтор-піридин-2-іл
A-319.	CH ₃	3-хлор-піридин-2-іл
A-320.	CH ₃	3-бромпіридин-2-іл
A-321.	CH ₃	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-322.	CH ₃	3-метил-піридин-2-іл
A-323.	CH ₃	3-етил-піридин-2-іл
A-324.	CH ₃	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-325.	CH ₃	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-326.	CH ₃	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-327.	CH ₃	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-328.	CH ₃	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-329.	CH ₃	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-330.	CH ₃	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-331.	CH ₃	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-332.	CH ₃	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-333.	CH ₃	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-334.	CH ₃	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-335.	CH ₃	5-нітро-піридин-2-іл
A-336.	CH ₃	5-ціано-піридин-2-іл
A-337.	CH ₃	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-338.	CH ₃	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-339.	CH ₃	5-метил-піридин-2-іл
A-340.	CH ₃	4-метил-піридин-2-іл
A-341.	CH ₃	6-метил-піридин-2-іл
A-342.	CH ₃	3-піридил
A-343.	CH ₃	2-хлор-піридин-3-іл
A-344.	CH ₃	2-бром-піридин-3-іл
A-345.	CH ₃	2-метил-піридин-3-іл
A-346.	CH ₃	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-347.	CH ₃	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-348.	CH ₃	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-349.	CH ₃	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-350.	CH ₃	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-351.	CH ₃	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-352.	CH ₃	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-353.	CH ₃	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл

A-354.	CH ₃	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-355.	CH ₃	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-356.	CH ₃	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-357.	CH ₃	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-358.	CH ₃	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-359.	CH ₃	4-піридил
A-360.	CH ₃	3-хлор-піридин-4-іл
A-361.	CH ₃	3-бром-піридин-4-іл
A-362.	CH ₃	3-метил-піридин-4-іл
A-363.	CH ₃	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-364.	CH ₃	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-365.	CH ₃	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-366.	CH ₃	4-піримідиніл
A-367.	CH ₃	5-хлорпіримідин-4-іл
A-368.	CH ₃	5-фторпіримідин-4-іл
A-369.	CH ₃	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-370.	CH ₃	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-371.	CH ₃	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-372.	CH ₃	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-373.	CH ₃	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-374.	CH ₃	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-375.	CH ₃	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-376.	CH ₃	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-377.	CH ₃	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-378.	CH ₃	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-379.	CH ₃	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-380.	CH ₃	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-381.	CH ₃	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-382.	CH ₃	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-383.	CH ₃	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-384.	CH ₃	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-385.	CH ₃	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-386.	CH ₃	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-387.	CH ₃	5-піримідиніл
A-388.	CH ₃	4-метил-піримідин-5-іл
A-389.	CH ₃	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-390.	CH ₃	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-391.	CH ₃	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-392.	CH ₃	2-піримідиніл
A-393.	CH ₃	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-394.	CH ₃	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-395.	CH ₃	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-396.	CH ₃	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-397.	CF ₃	феніл
A-398.	CF ₃	2-фторфеніл
A-399.	CF ₃	3-фторфеніл
A-400.	CF ₃	4-фторфеніл
A-401.	CF ₃	2-хлорфеніл
A-402.	CF ₃	3-хлорфеніл
A-403.	CF ₃	4-хлорфеніл
A-404.	CF ₃	3-бромфеніл
A-405.	CF ₃	4-бромфеніл

A-406.	CF ₃	2-трифторметилфеніл
A-407.	CF ₃	3-трифторметилфеніл
A-408.	CF ₃	4-трифторметилфеніл
A-409.	CF ₃	2-(метилтіо)феніл
A-410.	CF ₃	3-(метилтіо)феніл
A-411.	CF ₃	4-(метилтіо)феніл
A-412.	CF ₃	2-метоксифеніл
A-413.	CF ₃	3-метоксифеніл
A-414.	CF ₃	4-метоксифеніл
A-415.	CF ₃	4-нітрофеніл
A-416.	CF ₃	4-ціанофеніл
A-417.	CF ₃	4-трет.-бутилфеніл
A-418.	CF ₃	4-ізопропілфеніл
A-419.	CF ₃	3-етоксифеніл
A-420.	CF ₃	4-етоксифеніл
A-421.	CF ₃	4-п-пропоксифеніл
A-422.	CF ₃	3-ізопропоксифеніл
A-423.	CF ₃	4-ізопропоксифеніл
A-424.	CF ₃	4-п-буксифеніл
A-425.	CF ₃	4-трет.-буксифеніл
A-426.	CF ₃	4-(метоксиімінометил)феніл
A-427.	CF ₃	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-428.	CF ₃	2,3-дифторфеніл
A-429.	CF ₃	2,4-дифторфеніл
A-430.	CF ₃	2,5-дифторфеніл
A-431.	CF ₃	3,4-дифторфеніл
A-432.	CF ₃	3,5-дифторфеніл
A-433.	CF ₃	2,6-дифторфеніл
A-434.	CF ₃	2,4,6-трифторфеніл
A-435.	CF ₃	2,4,5-трифторфеніл
A-436.	CF ₃	2,3,4-трифторфеніл
A-437.	CF ₃	2,3,5-трифторфеніл
A-438.	CF ₃	3,4,5-трифторфеніл
A-439.	CF ₃	2,3-дихлорфеніл
A-440.	CF ₃	2,5-дихлорфеніл
A-441.	CF ₃	3,5-дихлорфеніл
A-442.	CF ₃	2,6-дихлорфеніл
A-443.	CF ₃	2,3-диметилфеніл
A-444.	CF ₃	2,4-диметилфеніл
A-445.	CF ₃	2,5-диметилфеніл
A-446.	CF ₃	2,4,5-триметилфеніл
A-447.	CF ₃	2,3-диметоксифеніл
A-448.	CF ₃	2,4-диметоксифеніл
A-449.	CF ₃	3,4-диметоксифеніл
A-450.	CF ₃	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-451.	CF ₃	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-452.	CF ₃	2-метил-3-метоксифеніл
A-453.	CF ₃	2-метил-4-метоксифеніл
A-454.	CF ₃	2-метил-6-метоксифеніл
A-455.	CF ₃	3-хлор-4-фторфеніл
A-456.	CF ₃	2-хлор-4-фторфеніл
A-457.	CF ₃	2-хлор-6-фторфеніл
A-458.	CF ₃	4-хлор-2-фторфеніл
A-459.	CF ₃	5-хлор-2-фторфеніл
A-460.	CF ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-461.	CF ₃	2-фтор-4-метилфеніл
A-462.	CF ₃	4-фтор-2-метилфеніл
A-463.	CF ₃	2-фтор-3-метоксифеніл
A-464.	CF ₃	2-фтор-4-метоксифеніл
A-465.	CF ₃	2-фтор-6-метоксифеніл
A-466.	CF ₃	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-467.	CF ₃	4-хлор-3-метилфеніл

A-468.	CF ₃	2-хлор-4-метилфеніл
A-469.	CF ₃	2-хлор-6-метилфеніл
A-470.	CF ₃	5-хлор-2-метилфеніл
A-471.	CF ₃	3-хлор-2-метилфеніл
A-472.	CF ₃	2-хлор-4-метоксифеніл
A-473.	CF ₃	2-хлор-6-метоксифеніл
A-474.	CF ₃	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-475.	CF ₃	3-фтор-4-метил феніл
A-476.	CF ₃	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-477.	CF ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-478.	CF ₃	3-фтор-4-метоксифеніл
A-479.	CF ₃	3-фтор-4-етоксифеніл
A-480.	CF ₃	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-481.	CF ₃	3-хлор-4-метилфеніл
A-482.	CF ₃	3-хлор-4-метоксифеніл
A-483.	CF ₃	3-хлор-4-етоксифеніл
A-484.	CF ₃	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-485.	CF ₃	3-метил-4-метоксифеніл
A-486.	CF ₃	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-487.	CF ₃	4-трет.-бутил-2-фторфеніл
A-488.	CF ₃	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-489.	CF ₃	4-етокси-2-фторфеніл
A-490.	CF ₃	4-ацетил-2-фторфеніл
A-491.	CF ₃	2-тієніл
A-492.	CF ₃	5-метилтіофен-2-іл
A-493.	CF ₃	4-метилтіофен-2-іл
A-494.	CF ₃	5-хлортіофен-2-іл
A-495.	CF ₃	3-ціанотіофен-2-іл
A-496.	CF ₃	5-формілтіофен-2-іл
A-497.	CF ₃	5-ацетилтіофен-2-іл
A-498.	CF ₃	5-(метоксиімінометил)тіофен-2-іл
A-499.	CF ₃	5-(1-(метоксиіміно)етил)тіофен-2-іл
A-500.	CF ₃	4-бромтіофен-2-іл
A-501.	CF ₃	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-502.	CF ₃	3-тієніл
A-503.	CF ₃	2-метилтіофен-3-іл
A-504.	CF ₃	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-505.	CF ₃	2,4,5-трихлор-тіофен-3-іл
A-506.	CF ₃	2-фурил
A-507.	CF ₃	5-метилфуран-2-іл
A-508.	CF ₃	5-хлорфуран-2-іл
A-509.	CF ₃	4-метилфуран-2-іл
A-510.	CF ₃	3-ціанофуран-2-іл
A-511.	CF ₃	5-ацетилфуран-2-іл
A-512.	CF ₃	3-фурил
A-513.	CF ₃	2-метилфуран-3-іл
A-514.	CF ₃	2,5-диметилфуран-3-іл
A-515.	CF ₃	2-піридил
A-516.	CF ₃	3-фтор-піридин-2-іл
A-517.	CF ₃	3-хлор-піридин-2-іл
A-518.	CF ₃	3-бромпіридин-2-іл
A-519.	CF ₃	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-520.	CF ₃	3-метил-піридин-2-іл
A-521.	CF ₃	3-етил-піридин-2-іл
A-522.	CF ₃	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-523.	CF ₃	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-524.	CF ₃	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-525.	CF ₃	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-526.	CF ₃	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл

A-527.	CF ₃	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-528.	CF ₃	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-529.	CF ₃	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-530.	CF ₃	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-531.	CF ₃	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-532.	CF ₃	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-533.	CF ₃	5-нітро-піридин-2-іл
A-534.	CF ₃	5-ціано-піридин-2-іл
A-535.	CF ₃	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-536.	CF ₃	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-537.	CF ₃	5-метил-піридин-2-іл
A-538.	CF ₃	4-метил-піридин-2-іл
A-539.	CF ₃	6-метил-піридин-2-іл
A-540.	CF ₃	3-піридил
A-541.	CF ₃	2-хлор-піридин-3-іл
A-542.	CF ₃	2-бром-піридин-3-іл
A-543.	CF ₃	2-метил-піридин-3-іл
A-544.	CF ₃	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-545.	CF ₃	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-546.	CF ₃	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-547.	CF ₃	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-548.	CF ₃	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-549.	CF ₃	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-550.	CF ₃	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-551.	CF ₃	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-552.	CF ₃	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-553.	CF ₃	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-554.	CF ₃	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-555.	CF ₃	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-556.	CF ₃	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-557.	CF ₃	4-піридил
A-558.	CF ₃	3-хлор-піридин-4-іл
A-559.	CF ₃	3-бром-піридин-4-іл
A-560.	CF ₃	3-метил-піридин-4-іл
A-561.	CF ₃	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-562.	CF ₃	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-563.	CF ₃	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-564.	CF ₃	4-піримідиніл
A-565.	CF ₃	5-хлорпіримідин-4-іл
A-566.	CF ₃	5-фторпіримідин-4-іл
A-567.	CF ₃	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-568.	CF ₃	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-569.	CF ₃	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-570.	CF ₃	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-571.	CF ₃	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-572.	CF ₃	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-573.	CF ₃	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-574.	CF ₃	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-575.	CF ₃	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-576.	CF ₃	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-577.	CF ₃	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-578.	CF ₃	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-579.	CF ₃	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-580.	CF ₃	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-581.	CF ₃	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-582.	CF ₃	2,5-диметил-піримідин-4-іл

A-583.	CF ₃	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-584.	CF ₃	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-585.	CF ₃	5-піримідиніл
A-586.	CF ₃	4-метил-піримідин-5-іл
A-587.	CF ₃	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-588.	CF ₃	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-589.	CF ₃	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-590.	CF ₃	2-піримідиніл
A-591.	CF ₃	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-592.	CF ₃	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-593.	CF ₃	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-594.	CF ₃	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-595.	OCH ₃	феніл
A-596.	OCH ₃	2-фторфеніл
A-597.	OCH ₃	3-фторфеніл
A-598.	OCH ₃	4-фторфеніл
A-599.	OCH ₃	2-хлорфеніл
A-600.	OCH ₃	3-хлорфеніл
A-601.	OCH ₃	4-хлорфеніл
A-602.	OCH ₃	3-бромфеніл
A-603.	OCH ₃	4-бромфеніл
A-604.	OCH ₃	2-трифторметилфеніл
A-605.	OCH ₃	3-трифторметилфеніл
A-606.	OCH ₃	4-трифторметилфеніл
A-607.	OCH ₃	2-(метилтіо)феніл
A-608.	OCH ₃	3-(метилтіо)феніл
A-609.	OCH ₃	4-(метилтіо)феніл
A-610.	OCH ₃	2-метоксифеніл
A-611.	OCH ₃	3-метоксифеніл
A-612.	OCH ₃	4-метоксифеніл
A-613.	OCH ₃	4-нітрофеніл
A-614.	OCH ₃	4-ціанофеніл
A-615.	OCH ₃	4-трет.-бутилфеніл
A-616.	OCH ₃	4-ізопропілфеніл
A-617.	OCH ₃	3-етоксифеніл
A-618.	OCH ₃	4-етоксифеніл
A-619.	OCH ₃	4-п-пропоксифеніл
A-620.	OCH ₃	3-ізопропоксифеніл
A-621.	OCH ₃	4-ізопропоксифеніл
A-622.	OCH ₃	4-п-бутоксифеніл
A-623.	OCH ₃	4-трет.-бутоксифеніл
A-624.	OCH ₃	4-(метоксиімінометил)феніл
A-625.	OCH ₃	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-626.	OCH ₃	2,3-дифторфеніл
A-627.	OCH ₃	2,4-дифторфеніл
A-628.	OCH ₃	2,5-дифторфеніл
A-629.	OCH ₃	3,4-дифторфеніл
A-630.	OCH ₃	3,5-дифторфеніл
A-631.	OCH ₃	2,6-дифторфеніл
A-632.	OCH ₃	2,4,6-трифторфеніл
A-633.	OCH ₃	2,4,5-трифторфеніл
A-634.	OCH ₃	2,3,4-трифторфеніл
A-635.	OCH ₃	2,3,5-трифторфеніл
A-636.	OCH ₃	3,4,5-трифторфеніл
A-637.	OCH ₃	2,3-дихлорфеніл
A-638.	OCH ₃	2,5-дихлорфеніл
A-639.	OCH ₃	3,5-дихлорфеніл
A-640.	OCH ₃	2,6-дихлорфеніл

A-641.	ОСН ₃	2,3-диметилфеніл
A-642.	ОСН ₃	2,4-диметилфеніл
A-643.	ОСН ₃	2,5-диметилфеніл
A-644.	ОСН ₃	2,4,5-триметилфеніл
A-645.	ОСН ₃	2,3-диметоксифеніл
A-646.	ОСН ₃	2,4-диметоксифеніл
A-647.	ОСН ₃	3,4-диметоксифеніл
A-648.	ОСН ₃	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-649.	ОСН ₃	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-650.	ОСН ₃	2-метил-3-метоксифеніл
A-651.	ОСН ₃	2-метил-4-метоксифеніл
A-652.	ОСН ₃	2-метил-6-метоксифеніл
A-653.	ОСН ₃	3-хлор-4-фторфеніл
A-654.	ОСН ₃	2-хлор-4-фторфеніл
A-655.	ОСН ₃	2-хлор-6-фторфеніл
A-656.	ОСН ₃	4-хлор-2-фторфеніл
A-657.	ОСН ₃	5-хлор-2-фторфеніл
A-658.	ОСН ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-659.	ОСН ₃	2-фтор-4-метилфеніл
A-660.	ОСН ₃	4-фтор-2-метилфеніл
A-661.	ОСН ₃	2-фтор-3-метоксифеніл
A-662.	ОСН ₃	2-фтор-4-метоксифеніл
A-663.	ОСН ₃	2-фтор-6-метоксифеніл
A-664.	ОСН ₃	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-665.	ОСН ₃	4-хлор-3-метилфеніл
A-666.	ОСН ₃	2-хлор-4-метилфеніл
A-667.	ОСН ₃	2-хлор-6-метилфеніл
A-668.	ОСН ₃	5-хлор-2-метилфеніл
A-669.	ОСН ₃	3-хлор-2-метилфеніл
A-670.	ОСН ₃	2-хлор-4-метоксифеніл
A-671.	ОСН ₃	2-хлор-6-метоксифеніл
A-672.	ОСН ₃	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-673.	ОСН ₃	3-фтор-4-метилфеніл
A-674.	ОСН ₃	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-675.	ОСН ₃	4-фтор-3-метилфеніл
A-676.	ОСН ₃	3-фтор-4-метоксифеніл
A-677.	ОСН ₃	3-фтор-4-етоксифеніл
A-678.	ОСН ₃	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-679.	ОСН ₃	3-хлор-4-метилфеніл
A-680.	ОСН ₃	3-хлор-4-метоксифеніл
A-681.	ОСН ₃	3-хлор-4-етоксифеніл
A-682.	ОСН ₃	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-683.	ОСН ₃	3-метил-4-метоксифеніл
A-684.	ОСН ₃	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-685.	ОСН ₃	4-трет.-бутил-2-фторфеніл
A-686.	ОСН ₃	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-687.	ОСН ₃	4-етокси-2-фторфеніл
A-688.	ОСН ₃	4-ацетил-2-фторфеніл
A-689.	ОСН ₃	2-тієніл
A-690.	ОСН ₃	5-метилтіофен-2-іл
A-691.	ОСН ₃	4-метилтіофен-2-іл
A-692.	ОСН ₃	5-хлортіофен-2-іл
A-693.	ОСН ₃	3-ціанотіофен-2-іл
A-694.	ОСН ₃	5-формілітіофен-2-іл
A-695.	ОСН ₃	5-ацетилтіофен-2-іл
A-696.	ОСН ₃	5-(метоксиімінометил)тіофен-2-іл
A-697.	ОСН ₃	5-(1-(метоксиіміно)етил)тіофен-2-іл
A-698.	ОСН ₃	4-бромтіофен-2-іл
A-699.	ОСН ₃	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-700.	ОСН ₃	3-тієніл

A-701.	ОСН ₃	2-метилтіофен-3-іл
A-702.	ОСН ₃	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-703.	ОСН ₃	2,4,5-трихлор-тіофен-3-іл
A-704.	ОСН ₃	2-фурил
A-705.	ОСН ₃	5-метилфуран-2-іл
A-706.	ОСН ₃	5-хлорфуран-2-іл
A-707.	ОСН ₃	4-метилфуран-2-іл
A-708.	ОСН ₃	3-ціанофуран-2-іл
A-709.	ОСН ₃	5-ацетилфуран-2-іл
A-710.	ОСН ₃	3-фурил
A-711.	ОСН ₃	2-метилфуран-3-іл
A-712.	ОСН ₃	2,5-диметилфуран-3-іл
A-713.	ОСН ₃	2-піридил
A-714.	ОСН ₃	3-фтор-піридин-2-іл
A-715.	ОСН ₃	3-хлор-піридин-2-іл
A-716.	ОСН ₃	3-бромпіридин-2-іл
A-717.	ОСН ₃	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-718.	ОСН ₃	3-метил-піридин-2-іл
A-719.	ОСН ₃	3-етил-піридин-2-іл
A-720.	ОСН ₃	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-721.	ОСН ₃	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-722.	ОСН ₃	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-723.	ОСН ₃	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-724.	ОСН ₃	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-725.	ОСН ₃	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-726.	ОСН ₃	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-727.	ОСН ₃	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-728.	ОСН ₃	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-729.	ОСН ₃	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-730.	ОСН ₃	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-731.	ОСН ₃	5-нітро-піридин-2-іл
A-732.	ОСН ₃	5-ціано-піридин-2-іл
A-733.	ОСН ₃	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-734.	ОСН ₃	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-735.	ОСН ₃	5-метил-піридин-2-іл
A-736.	ОСН ₃	4-метил-піридин-2-іл
A-737.	ОСН ₃	6-метил-піридин-2-іл
A-738.	ОСН ₃	3-піридил
A-739.	ОСН ₃	2-хлор-піридин-3-іл
A-740.	ОСН ₃	2-бром-піридин-3-іл
A-741.	ОСН ₃	2-метил-піридин-3-іл
A-742.	ОСН ₃	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-743.	ОСН ₃	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-744.	ОСН ₃	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-745.	ОСН ₃	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-746.	ОСН ₃	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-747.	ОСН ₃	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-748.	ОСН ₃	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-749.	ОСН ₃	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-750.	ОСН ₃	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-751.	ОСН ₃	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-752.	ОСН ₃	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-753.	ОСН ₃	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-754.	ОСН ₃	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-755.	ОСН ₃	4-піридил
A-756.	ОСН ₃	3-хлор-піридин-4-іл
A-757.	ОСН ₃	3-бром-піридин-4-іл
A-758.	ОСН ₃	3-метил-піридин-4-іл
A-759.	ОСН ₃	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-760.	ОСН ₃	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-761.	ОСН ₃	3,5-диметил-піридин-4-іл

A-762.	ОСН ₃	4-піримідиніл
A-763.	ОСН ₃	5-хлорпіримідин-4-іл
A-764.	ОСН ₃	5-фторпіримідин-4-іл
A-765.	ОСН ₃	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-766.	ОСН ₃	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-767.	ОСН ₃	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-768.	ОСН ₃	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-769.	ОСН ₃	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-770.	ОСН ₃	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-771.	ОСН ₃	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-772.	ОСН ₃	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-773.	ОСН ₃	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-774.	ОСН ₃	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-775.	ОСН ₃	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-776.	ОСН ₃	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-777.	ОСН ₃	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-778.	ОСН ₃	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-779.	ОСН ₃	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-780.	ОСН ₃	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-781.	ОСН ₃	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-782.	ОСН ₃	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-783.	ОСН ₃	5-піримідиніл
A-784.	ОСН ₃	4-метил-піримідин-5-іл
A-785.	ОСН ₃	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-786.	ОСН ₃	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-787.	ОСН ₃	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-788.	ОСН ₃	2-піримідиніл
A-789.	ОСН ₃	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-790.	ОСН ₃	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-791.	ОСН ₃	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-792.	ОСН ₃	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-793.	Cl	феніл
A-794.	Cl	2-фторфеніл
A-795.	Cl	3-фторфеніл
A-796.	Cl	4-фторфеніл
A-797.	Cl	2-хлорфеніл
A-798.	Cl	3-хлорфеніл
A-799.	Cl	4-хлорфеніл
A-800.	Cl	3-бромфеніл
A-801.	Cl	4-бромфеніл
A-802.	Cl	2-трифторметилфеніл
A-803.	Cl	3-трифторметилфеніл
A-804.	Cl	4-трифторметилфеніл
A-805.	Cl	2-(метилтіо)феніл
A-806.	Cl	3-(метилтіо)феніл
A-807.	Cl	4-(метилтіо)феніл
A-808.	Cl	2-метоксифеніл
A-809.	Cl	3-метоксифеніл
A-810.	Cl	4-метоксифеніл
A-811.	Cl	4-нітрофеніл
A-812.	Cl	4-ціанфеніл
A-813.	Cl	4-трет.-бутилфеніл

A-814.	Cl	4-ізопропілфеніл
A-815.	Cl	3-етоксифеніл
A-816.	Cl	4-етоксифеніл
A-817.	Cl	4-н-пропоксифеніл
A-818.	Cl	3-ізопропоксифеніл
A-819.	Cl	4-ізопропоксифеніл
A-820.	Cl	4-н-бутоксифеніл
A-821.	Cl	4-трет.-бутоксифеніл
A-822.	Cl	4-(метоксиімінометил)феніл
A-823.	Cl	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-824.	Cl	2,3-дифторфеніл
A-825.	Cl	2,4-дифторфеніл
A-826.	Cl	2,5-дифторфеніл
A-827.	Cl	3,4-дифторфеніл
A-828.	Cl	3,5-дифторфеніл
A-829.	Cl	2,6-дифторфеніл
A-830.	Cl	2,4,6-трифторфеніл
A-831.	Cl	2,4,5-трифторфеніл
A-832.	Cl	2,3,4-трифторфеніл
A-833.	Cl	2,3,5-трифторфеніл
A-834.	Cl	3,4,5-трифторфеніл
A-835.	Cl	2,3-дихлорфеніл
A-836.	Cl	2,5-дихлорфеніл
A-837.	Cl	3,5-дихлорфеніл
A-838.	Cl	2,6-дихлорфеніл
A-839.	Cl	2,3-диметилфеніл
A-840.	Cl	2,4-диметилфеніл
A-841.	Cl	2,5-диметилфеніл
A-842.	Cl	2,4,5-триметилфеніл
A-843.	Cl	2,3-диметоксифеніл
A-844.	Cl	2,4-диметоксифеніл
A-845.	Cl	3,4-диметоксифеніл
A-846.	Cl	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-847.	Cl	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-848.	Cl	2-метил-3-метоксифеніл
A-849.	Cl	2-метил-4-метоксифеніл
A-850.	Cl	2-метил-6-метоксифеніл
A-851.	Cl	3-хлор-4-фторфеніл
A-852.	Cl	2-хлор-4-фторфеніл
A-853.	Cl	2-хлор-6-фторфеніл
A-854.	Cl	4-хлор-2-фторфеніл
A-855.	Cl	5-хлор-2-фторфеніл
A-856.	Cl	4-фтор-3-метилфеніл
A-857.	Cl	2-фтор-4-метилфеніл
A-858.	Cl	4-фтор-2-метилфеніл
A-859.	Cl	2-фтор-3-метоксифеніл
A-860.	Cl	2-фтор-4-метоксифеніл
A-861.	Cl	2-фтор-6-метоксифеніл
A-862.	Cl	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-863.	Cl	4-хлор-3-метилфеніл
A-864.	Cl	2-хлор-4-метилфеніл
A-865.	Cl	2-хлор-6-метилфеніл
A-866.	Cl	5-хлор-2-метилфеніл
A-867.	Cl	3-хлор-2-метилфеніл
A-868.	Cl	2-хлор-4-метоксифеніл
A-869.	Cl	2-хлор-6-метоксифеніл
A-870.	Cl	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-871.	Cl	3-фтор-4-метилфеніл
A-872.	Cl	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-873.	Cl	4-фтор-3-метилфеніл
A-874.	Cl	3-фтор-4-метоксифеніл
A-875.	Cl	3-фтор-4-етоксифеніл

A-876.	Cl	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-877.	Cl	3-хлор-4-метилфеніл
A-878.	Cl	3-хлор-4-метоксифеніл
A-879.	Cl	3-хлор-4-етоксифеніл
A-880.	Cl	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-881.	Cl	3-метил-4-метоксифеніл
A-882.	Cl	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-883.	Cl	4-трет.-бутил-2-фторфеніл
A-884.	Cl	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-885.	Cl	4-етокси-2-фторфеніл
A-886.	Cl	4-ацетил-2-фторфеніл
A-887.	Cl	2-тієніл
A-888.	Cl	5-метилтіофен-2-іл
A-889.	Cl	4-метилтіофен-2-іл
A-890.	Cl	5-хлортіофен-2-іл
A-891.	Cl	3-ціанотіофен-2-іл
A-892.	Cl	5-формілтіофен-2-іл
A-893.	Cl	5-ацетилтіофен-2-іл
A-894.	Cl	5-(метоксиминометил)тіофен-2-іл
A-895.	Cl	5-(1-(метоксимино)етил)тіофен-2-іл
A-896.	Cl	4-бромтіофен-2-іл
A-897.	Cl	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-898.	Cl	3-тієніл
A-899.	Cl	2-метилтіофен-3-іл
A-900.	Cl	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-901.	Cl	2,4,5-трихлор-тіофен-3-іл
A-902.	Cl	2-фурил
A-903.	Cl	5-метилфуран-2-іл
A-904.	Cl	5-хлорфуран-2-іл
A-905.	Cl	4-метилфуран-2-іл
A-906.	Cl	3-ціанофуран-2-іл
A-907.	Cl	5-ацетилфуран-2-іл
A-908.	Cl	3-фурил
A-909.	Cl	2-метилфуран-3-іл
A-910.	Cl	2,5-диметилфуран-3-іл
A-911.	Cl	2-піридил
A-912.	Cl	3-фтор-піридин-2-іл
A-913.	Cl	3-хлор-піридин-2-іл
A-914.	Cl	3-бромпіридин-2-іл
A-915.	Cl	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-916.	Cl	3-метил-піридин-2-іл
A-917.	Cl	3-етил-піридин-2-іл
A-918.	Cl	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-919.	Cl	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-920.	Cl	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-921.	Cl	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-922.	Cl	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-923.	Cl	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-924.	Cl	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-925.	Cl	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-926.	Cl	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-927.	Cl	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-928.	Cl	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-929.	Cl	5-нітро-піридин-2-іл
A-930.	Cl	5-ціано-піридин-2-іл
A-931.	Cl	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-932.	Cl	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-933.	Cl	5-метил-піридин-2-іл
A-934.	Cl	4-метил-піридин-2-іл

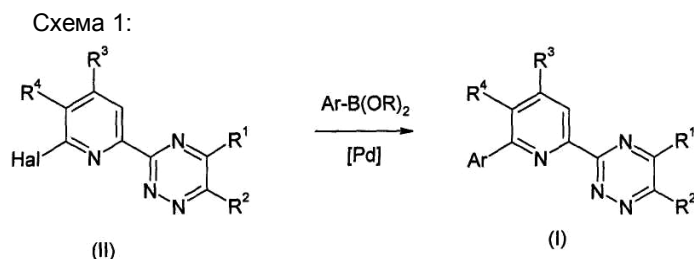
A-935.	Cl	6-метил-піридин-2-іл
A-936.	Cl	3-піридил
A-937.	Cl	2-хлор-піридин-3-іл
A-938.	Cl	2-бром-піридин-3-іл
A-939.	Cl	2-метил-піридин-3-іл
A-940.	Cl	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-941.	Cl	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-942.	Cl	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-943.	Cl	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-944.	Cl	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-945.	Cl	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-946.	Cl	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-947.	Cl	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-948.	Cl	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-949.	Cl	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-950.	Cl	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-951.	Cl	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-952.	Cl	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-953.	Cl	4-піридил
A-954.	Cl	3-хлор-піридин-4-іл
A-955.	Cl	3-бром-піридин-4-іл
A-956.	Cl	3-метил-піридин-4-іл
A-957.	Cl	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-958.	Cl	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-959.	Cl	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-960.	Cl	4-піримідиніл
A-961.	Cl	5-хлорпіримідин-4-іл
A-962.	Cl	5-фторпіримідин-4-іл
A-963.	Cl	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-964.	Cl	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-965.	Cl	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-966.	Cl	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-967.	Cl	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-968.	Cl	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-969.	Cl	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-970.	Cl	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-971.	Cl	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-972.	Cl	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-973.	Cl	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-974.	Cl	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-975.	Cl	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-976.	Cl	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-977.	Cl	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-978.	Cl	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-979.	Cl	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-980.	Cl	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-981.	Cl	5-піримідиніл
A-982.	Cl	4-метил-піримідин-5-іл
A-983.	Cl	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-984.	Cl	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-985.	Cl	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-986.	Cl	2-піримідиніл
A-987.	Cl	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-988.	Cl	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл

A-989.	Cl	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-990.	Cl	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл

Відповідно до винаходу сполуки загальної формули I можуть бути одержані по аналогії з наведе-

ним на початку рівнем техніки за допомогою стандартних методів органічного синтезу.

Сполуки формули I, в якій R⁵ означає при необхідності заміщений феніл або гетероарил, можуть бути одержані, наприклад, відповідно до способу зображеного на схемі 1:



В схемі 1 R¹, R², R³ і R⁴ мають наведені вище значення. Ar означає при необхідності заміщений феніл або при необхідності заміщений 5- або 6-членний гетарил. R означає H або C₁-C₄-алкіл або з іншими молекулами Ar-B(OR)₂ утворює ангідрид фенілборної кислоти. Hal означає хлор, бром або йод.

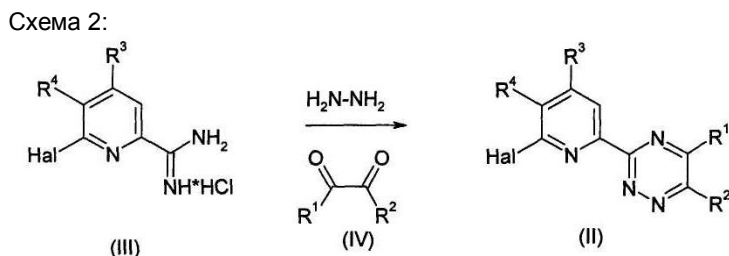
Відповідно до схеми 1 2-(6-галопіридин-2-іл)тріазин формули II піддається взаємодії з похідним (гет)арилборної кислоти загальної формули Ar-B(OR)₂ при умовах сполучення Сузукі (Suzuki), тобто в присутності палладієвого каталізатора при відомих умовах реакції, які, наприклад, відомі з Acc. Chem. Res. 15, S. 178-184 (1982), Chem. Rev. 95, S. 2457-2483 (1995), і процитованих там літературних джерел, а також з J. Org. Chem. 68, S. 9412 (2003). Придатними каталізаторами є особливо тетракіс(трифенілфосфін)палладій(0), хлорид біс(трифенілфосфін)палладію(II), хлорид біс(ацетонітрил)палладію(II), хлорид-дихлорметановий комплекс [1,1'-біс-(дифенілфосфіно)ферроцен]палладію(II), біс-[1,2-біс(дифенілфосфін)етан]палладій(0) і хлорид [1,4-біс(дифенілфосфін)бутан]палладію(II). Кількість каталізатора становить звичайно від 0,1 до 10 моль-%, в перерахуванні на сполуку II. Молярне відношення сполуки II до похідного (гет)арилборної кислоти знаходиться типово в межах від 1:2 до 2:1.

Аналогічним чином зі схемою 1 можуть бути одержані сполуки формули I, в якій R⁵ означає алкіл, циклоалкіл, при необхідності заміщений бензил або гетероарилметил, шляхом каталізованої реакції сполучення перехідних металів за допомогою взаємодії сполуки II з металоорганічною сполукою Met-R⁵, в якій R⁵ має зазначене вище значення і Met означає залишок MgX, SnR₃ або ZnX (X = хлор, бром або йод, R = алкіл), наприклад, в змісті сполучення Стілле (Stille) або сполучення Кумада (Kumada).

Аналогічним чином зі схемою 1 можуть бути одержані сполуки формули I, в якій R⁵ означає алкокси, галоалкокси, циклоалкокси, при необхідності заміщений фенокси або гетероарилкокси, за допомогою взаємодії сполуки II з відповідним алкоголятом OR⁵, в якій R⁵ має зазначене вище значення, в змісті нуклеофільного заміщення.

3-(6-галогенпіридин-2-іл)-тріазини формули II зі свого боку можуть бути одержані відповідно до методів, зображених на наведених нижче схемах з відповідних амідинових сполук формули III.

Одержання сполуки II, в якій R¹, R² незалежно один від іншого означають алкіл, галогеналкіл або разом з C-атомами, до яких вони прив'язані, утворюють насичений карбоцикл або гетероцикл відповідно до зазначеного вище визначення, вдається, наприклад, відповідно до синтезу, зображеного на схемі 2.



В схемі 2 Hal, R³ і R⁴ мають наведені вище значення. R¹ і R² незалежно один від іншого означають C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-галогеналкіл або утворюють разом з C-атомами, до яких вони прив'язані, насичений карбоцикл або гетероцикл, наприклад, один з зазначених вище циклів Q-1, Q-4 або Q-8. Відповідно до схеми 2 амідинова сполу-

ка формули III послідовно або як реакція в одній посудині взаємодіє з гідрaziном і сполукою IV, причому одержують сполуку формули II. Як правило, спочатку відбувається взаємодія з гідрaziном, який типово використовується у вигляді гідразингідрату. Потім додають сполуку IV. При

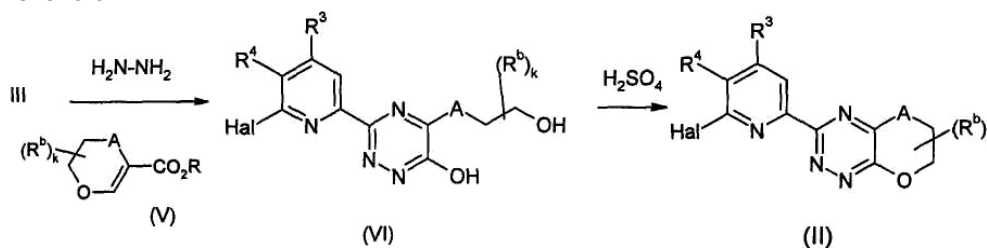
необхідності для доповнення взаємодії підвищують температуру.

Сполуки формули IV є відомими або можуть бути одержані відповідно до стандартних способів, наприклад, згідно з EP 267 378, Tetrahedron Letters, 2003, S. 2307, Tetrahedron Letters, 1992, S. 8131, Tetrahedron Letters, 1987, S. 551, J. Molec. Catalysis 208 (1-2), 2004, S. 135-145. Одержання 3,4-діоксаоксолану вдається здійснити, наприклад, за допомогою окислення 3,4-бисгідроксіоксолану N-бромсукцинімидом і тетрафлорметаном в піридині (див. Tetrahedron Letters, 44 (2003) S. 4909

або о-йодозобензойною кислотою в диметилсульфоксиді (див. Tetrahedron Letters, 35 (1994) S. 8019). Амідинові сполуки III рівним чином відомі або можуть бути одержані, наприклад, аналогічно методам, описаним в US 2003/0087940 A1 і Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003).

Аналогічним чином зі схемою II сполуки формули II, в якій R^1 і R^2 разом з C-атомами, до яких вони прив'язані, означають залишок Q-2 або Q-3, можуть бути одержані шляхом синтезу, наведеним на схемах 3 і 4:

Схема 3:



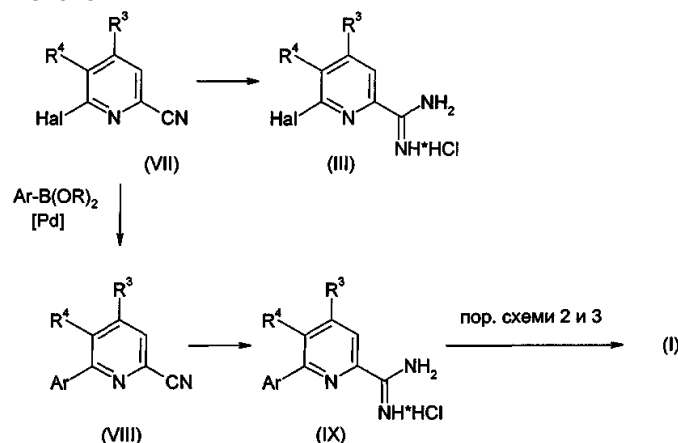
В схемі 3 Hal, k, R^b , R^3 і R^4 мають наведені вище значення. A означає CH_2 або хімічний зв'язок. R означає C_1 - C_4 -алкіл, особливо метил або етил. Відповідно до схеми амідинова сполука III послідовно піддається взаємодії з гідразиним і складним ефіром формули V. Наведене для схеми 2 аналогічним чином відноситься до умов реакції. Одержана таким чином бисгідрокси сполука формули VI потім піддається циклічній дегідратації, наприклад, шляхом обробки сірчаною кислотою. Складні ефіри формули V є відомими або можуть бути одержані аналогічно способам, відомим з літературних джерел (див. J. Heterocycl. Chem., 32 (1995) стор. 735 і Liebigs Ann. Chem. 1974, стор. 468-476).

Сполуки загальної формули III зі свого боку можуть бути одержані з відповідних 2-ціанопіридинових сполук загальної формули VII (див. Схема 4). Для цього 2-ціанопіридину сполуку VII відповідно до методу, описаного в US 4,873,248 шляхом послідовної обробки алкоголем лужного металу, таким як метанолат натрію

або етанолат натрію і наступною взаємодією з хлоридом амонію переводять в сполуку III. Замість гідрохлоридів в показаних на схемах з 1 по 3 послідовних стадіях також можуть використатися гідроброміди, ацетати, сульфати або формиати. Ціанопіридини формули VII є відомими, наприклад, з US 2003/087940, WO 2004/026305, WO 01/057046 і Bioorg. Med. Chem. Lett. S. 1571-1574 (2003) або можуть бути одержані відповідно до відомих способів одержання.

Відповідно до другого шляху синтезу (див. схему 4) можуть бути одержані сполуки відповідно до винаходу, в яких R^5 означає залишок Ar, як визначено на схемі 1, виходячи з ціанопіридинів VII. Для цього спочатку здійснюють сполучення сполуки VII зі сполукою (гет)арилборної кислоти $Ar-B(OR)_2$, як описано для схеми 1, і одержаний при цьому 6-(гет)арил-2-ціанопіридин при описаних для сполуки VII умовах реакції перетворюють в амідинову сполуку IX. Потім при зазначених для схем 2 і 3 умовах сполука IX може бути переведеною в відповідну тріазинову сполуку.

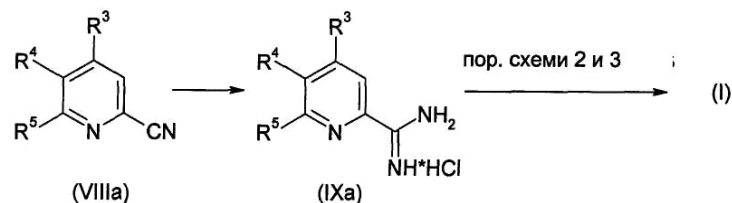
Схема 4:



Втім, сполуки формули VIIIa є відомими, де R⁵ має одне з зазначених раніше значень, особливо значення, що відрізняється від Ag. Сполуки VIIIa

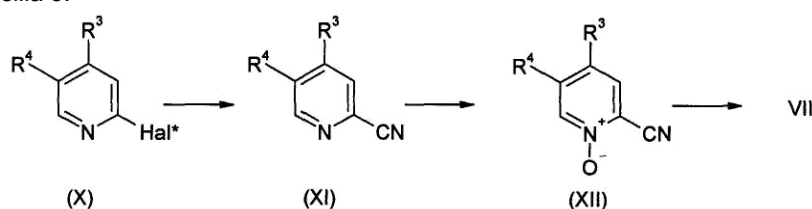
можуть бути перетворені аналогічно методам зі схем з 2 по 4 у відповідні сполуки I згідно з винаходом:

Схема 4a:



Сполуки загальної формули VII загалом не є відомими і можуть бути одержані, особливо згідно з наведеним на схемі 5 способом.

Схема 5:



В схемі 5 R³ і R⁴ мають наведені вище значення. Hal* означає хлор, бром або йод.

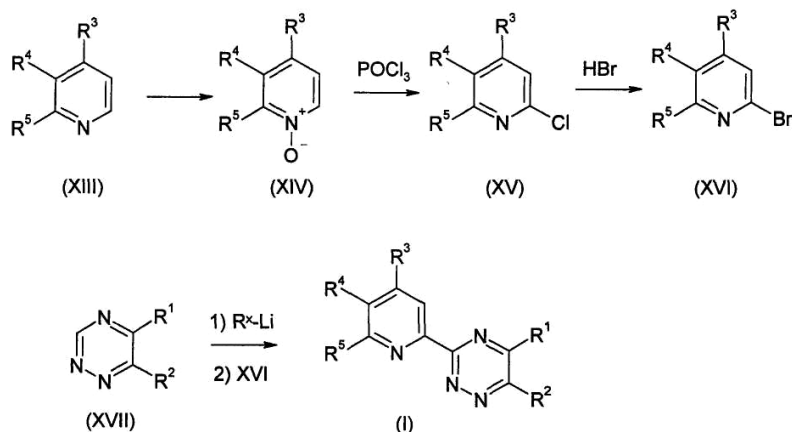
Перетворення 2-галогенпіридину X в 2-ціанопіридин XI вдається здійснити згідно зі стандартними методами органічної хімії шляхом взаємодії X з іонами ціаніду, наприклад, з ціанідом натрію або ціанідом калію (див. EP-A 97460, Приклад одержання 1), ціанідом міді(I) (див. EP-A 34917, Приклад одержання 3) або ціанідом триметилсилілу. Потім одержану таким чином сполуку XI шляхом обробки надкислотою відповідно до відомих методів перетворюють в піридин-N-оксид XII. Перетворення XI в XII може здійснюватися по аналогії з відомими способами, наприклад, шляхом обробки XI пероксидом водню в органічній кислоті, такий як мурашина кислота, оцтова кислота, хлороцтова кислота або трифтороцтова кислота (див. наприклад, J. Org. Chem. 55, S. 738-741 (1990) і Organic Synthesis, Collect. т. IV, S. 655-656 (1963)) або шляхом взаємодії XI з органічною надкислотою, такою як мета-хлорпербензойна кислота в інертному розчиннику, наприклад, галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан (див. наприклад, Synthetic Commun. 22 (18), стор. 2645, (1992); J. Med. Chem. 2146 (1998)). Перетворення XI в XII вдається здійснити також по аналогії з описаним методом К. В. Sharpless (J.

Org. Chem. 63(5), стор. 7740 (1998)) шляхом взаємодії XI пероксидом водню в галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан в присутності каталітичних кількостей (наприклад, 5мас.-%) сполуки ренію(VII), такого як метилтриоксореній (H₃CrEO₃).

Потім XII взаємодіє з засобом, що галогенує, таким як POCl₃ або POBr₃, причому одержують відповідну сполуку VII. При взаємодії XII до одержання VII використовують засіб, що галогенує, як правило, в надлишку, в перерахуванні на стехіометрію реакції. Взаємодія може бути проведена в інертному органічному розчиннику і часто здійснюють при відсутності розчинника, причому в такому випадку, як правило, засіб, що галогенує діє як розчинник. Температура реакції знаходиться звичайно в межах від 20°C до температури кипіння засобу, що галогенує. При необхідності є вигідним, спочатку за допомогою засобу, що хлорує, такого як POCl₃ один атом хлору ввести у 2-положення піридин-N-оксиду XII і потім зробити галогенний обмін, наприклад, шляхом обробки HBr або засобом, що йодує, причому одержують сполуку формули VII з Hal = Br або I.

Далі можливо одержати сполуки відповідно до винаходу I відповідно до синтезу, представленого на схемі 6:

Схема 6:



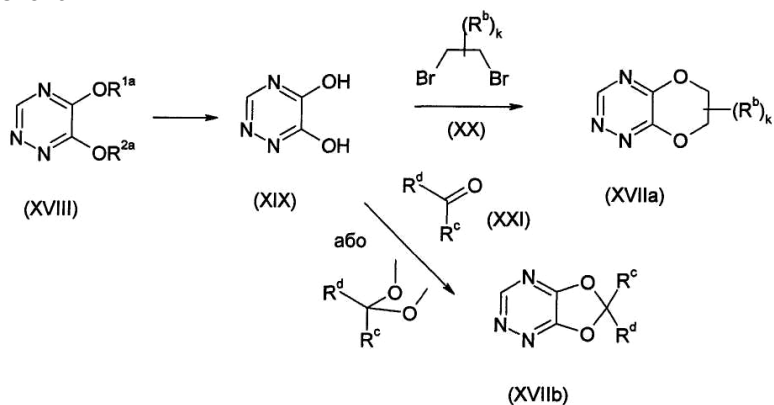
В схемі 6 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і R^5 мають наведені вище значення. R^x означає наприклад, C_1 - C_6 -алкіл, особливо n -бутил, або феніл.

Відповідно до схеми 6 на першій стадії піридину сполуку XIII згідно зі стандартними методами органічною хімії переводять у відповідний N-оксид XIV. Відповідно можуть застосовуватися методи, наведені на схемі 5 для перетворення сполуки XI в сполуку XII. Потім N-оксид XIV шляхом взаємодії з засобом, що хлорує, таким як POCl_3 перетворюють у відповідний 2-хлорпіридин XV. Відповідно можуть застосовуватися методи, наведені на схемі 5 для перетворення сполуки XII в сполуку VII. Потім здійснюють хлор-бром обмін згідно зі стандартними методами органічної хімії, наприклад, шляхом обробки хлорпіридину XV за допомогою HBr по аналогії з методом, наведеним в US 5,271,217 і Can. J. Chem. 75 (2) (1997) стор. 169.

Одержаний таким чином бромпіридин потім сполучають з тріазиновою сполукою XVII. Для цього тріазиновою сполукою формули XVII шляхом обробки літєвою основою, особливо сполукою C_1 - C_6 -алкіллітію, такою як n -бутиллітію або феніллітію переводять у відповідну тріазиновою сполуку літію, яку потім вводять в реакцію зі сполукою бромпіридину XVI. Взаємодія XVI з літійованою сполукою XVII може бути проведена по аналогії з методом, описаним в Tetrahedron Lett. 41(10) (2000) стор. 1653.

Тріазинові сполуки XVII є відомими або можуть бути одержані по аналогії з відомими методами одержання тріазинових сполук. Тріазинові сполуки XVII, в яких R^1 і R^2 означають прив'язані киснем залишки можуть бути одержані виходячи з 5,6-діалкокси-1,2,4-тріазинів, таких як 5,6-диметокси-1,2,4-тріазин (див. Chem. Ber. 109 (1976), стор.1113):

Схема 7:



В схемі 7 R^b і k мають наведені вище значення. R^{1a} і R^{1b} означають C_1 - C_6 -алкіл, особливо метил. R^c і R^d незалежно один від іншого означають водень або C_1 - C_4 -алкіл. Перетворення XVIII в 5,6-бисгидрокси-1,2,4-тріазин вдається здійснити по аналогії з методами, описаними в Chem. Ber. 109 (1976), стор.1113. Одержаний таким чином бисгидрокси-тріазин XIX потім може піддаватися взаємодії з 1,2-дибромалканом XX, переважно в присутності основи, такої як гідроксид лужного металу або алкоголят лужного металу по аналогії з методом,

описаним в Heterocycl. Chem. 27 (1990) стор. 151, причому одержують конденсований тріазин XVIIa. Крім того, бисгидрокси-тріазин XIX по аналогії з методом, описаним в Chem. Berichte 124(3) (1991) стор. 481, J.Chem. Socl., Perkin Trans 1, 1998, стор. 3561; Synthesis (1986), стор. 122; може взаємодіяти з кетоном відповідно альдегідом XXI, причому одержують конденсований тріазин XVIIb.

Реакційні суміші, одержані згідно з представленими на схемах з 1 по 7 методами, переробляють звичайним способом, наприклад, шляхом змі-

шування з водою, розділення фаз і при необхідності хроматографічного очищення вихідних продуктів. Проміжні і кінцеві продукти утворюються частково у вигляді безбарвних або злегка коричнюватих, грузлих олій, які при зниженому тиску і при помірно підвищеній температурі звільняються або очищуються від летких компонентів. Оскільки проміжні і кінцеві продукти одержують як тверді речовини, очищення може також здійснюватися шляхом перекристалізації або дигерування.

Оскільки окремі сполуки I не є доступними описаними вище шляхами, то вони можуть бути одержані шляхом дериватизації інших сполук I.

Оскільки при синтезі утворюються суміші ізомерів, то в цілому розділення не є безумовно необхідним, тому що окремі ізомери частково під час приготування для застосування або при застосуванні (наприклад, під впливом світла, кислоти або основи) можуть перетворюватися один в іншого. Відповідні перетворення можуть також здійснюватися після застосування, наприклад, при обробці рослин, в оброблених рослинах або в шкідливому грибі, з яким ведеться боротьба.

Сполуки формули I придатні як фунгіциди. Вони відзначені надзвичайною дією проти широкого спектру фітопатогенних грибів з класу аскоміцетів, дейтеромицетів, оомицетів і базидіомицетів, особливо з класу оомицетів. Частково вони є системно активними і можуть використатися для захисту рослин як листяні, протравлювальні і ґрунтові фунгіциди.

Вони мають особливе значення для боротьби з цілим рядом грибів на різних культурних рослинах, таких як пшениця, жито, ячмінь, овес, рис, кукурудза, трава, банани, бавовник, соя, кава, цукровий очерет, виноград, фруктових і декоративних рослинах і овочевих культурах, таких як огірки, боби, томати, картопля і тиква, а також на насінні цих рослин.

Особливо вони придатні для боротьби з наступними захворюваннями рослин:

- Види *Alternaria* на овочах, рапсі, цукровому буряку, фруктах, рисі, соєвих бобах, а також на картоплі (наприклад, *A. solani* або *A. alternata*) і томатах (наприклад, *A. solani* або *A. alternata*) і *Alternaria* ssp. (колосова чернь) на пшениці,
- види *Aphanomyces* на цукровому буряку і овочах,
- види *Ascochyta* на зернових і овочах, наприклад, *Ascochyta tritici* (аскохитоз) на пшениці,
- види *Bipolaris*- і *Drechslera* на кукурудзі, зернових, рисі і дернині (наприклад, *D. maydis* на кукурудзі, *D. teres* на ячмені, *D. tritici-repentis* на пшениці),
- *Blumeria graminis* (справжня борошниста роса) на зернових (наприклад, пшениці або ячмені),
- *Botrytis cinerea* (сіра гнилизна) на полуниці, овочах, квітах, пшениці і виноградних лозах,
- *Bremia lactucae* на салаті,
- види *Cercospora* на кукурудзі, соєвих бобах, рисі і цукровому буряку і наприклад, *Cercospora sojae* (церкоспороз сої) або *Cercospora kikuchii* (церкоспороз пурпурний) на соєвих бобах,
- *Cladosporium herbarum* (колосова чернь) на пшениці,

- види *Cochliobolus* на кукурудзі, зернових, рисі (наприклад, *Cochliobolus sativus* на зернових, *Cochliobolus miyabeanus* на рисі),

- види *Colletotricum* на соєвих бобах, бавовнику і інших рослинах (наприклад, *C. acutatum* на різних рослинах) і наприклад, *Colletotrichum truncatum* (антракноз) на соєвих бобах),

- *Corynespora cassiicola* (листяна плямистість) на соєвих бобах,

- *Dematophora necatrix* (коренева/стеблова гнилизна) на соєвих бобах,

- *Diaporthe phaseolorum* (захворювання стебла) на соєвих бобах,

- види *Drechslera*, види *Pyrenophora* на кукурудзі, зернових, рисі і дернині, на ячмені (наприклад, *D. teres*) і на пшениці (наприклад, *D. tritici-repentis*),

- *Esca* на виноградній лозі, викликана *Phaeoacremonium chlamydosporium*, *Ph. Aleophilum*, і *Formitipora punctata* (син. *Phellinus punctatus*),

- *Elsinoe ampelina* на виноградній лозі,

- *Epicoccum* spp. (колосова чернь) на пшениці,

- *Exserohilum* види на кукурудзі,

- *Erysiphe cichoracearum* і *Sphaerotheca fuliginea* на баштанних,

- види *Fusarium* і *Verticillium* (наприклад, *V. dahliae*) на різних рослинах: наприклад, *F. graminearum* або *F. culmorum* (коренева гнилизна) на зернових (наприклад, пшениці або ячмені) або наприклад, *F. oxysporum* на томатах і *Fusarium solani* (захворювання стебла) на соєвих бобах,

- *Gaeumannomyces graminis* на зернових (наприклад, пшениці або ячмені),

- *Gibberella* види на зернових і рисі (наприклад, *Gibberella fujikuroi* на рисі),

- *Glomerella cingulata* на виноградній лозі і інших рослинах,

- *Grainstaining complex* на рисі,

- *Guignardia budwelli* на виноградній лозі,

- види *Helminthosporium* (наприклад, *H. graminicola*) на кукурудзі і рисі,

- *Isariopsis clavispora* на виноградній лозі,

- *Macrophomina phaseolina* (коренева/стеблова гнилизна) на соєвих бобах,

- *Microdochium nivale* на зернових (наприклад, на пшениці або ячмені),

- *Microsphaera diffusa* (справжня борошниста роса) на соєвих бобах,

- види *Mycosphaerella* на зернових, бананах і земляному горі (M. *graminicola* на пшениці, M. *fijensis* на банані),

- види *Peronospora* на капусті (наприклад, P. *brassicae*), на луковичних рослинах (наприклад, P. *destructor*) і наприклад, *Peronospora manshurica* (Falscher Mehltau) на соєвих бобах,

- *Phakopsara pachyrhizi* і *Phakopsara meibomia* на соєвих бобах,

- *Phialophora gregata* (захворювання стебла) на соєвих бобах,

- види *Phomopsis* на соєвих бобах, соняшнику і виноградних лозах (P. *viticola* на виноградних лозах, P. *helianthii* на соняшнику),

- види *Phytophthora* на різних рослинах, наприклад, P. *capsici* на паприці, *Phytophthora megasperma* (листяна/стеблова гнилизна) на соє-

вих бобах, *Phytophthora infestans* на картоплі і томатах,

- *Plasmopara viticola* на виноградних лозах,
- *Podosphaera leucotricha* на яблунях,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* на зернових,

- *Pseudoperonospora* види на хмелю і баштанних (наприклад, *P. cubensis* на огурцях або *P. humilis* на хмелю)

- *Pseudopezicula tracheiphilae* на виноградній лозі,

- види *Puccinia* на різних рослинах, наприклад, *P. trititica*, *P. striiformis*, *P. hordei* або *P. graminis* на зернових (наприклад, пшениці або ячмені) або на спаржі (наприклад, *P. asparagi*),

- види *Pyrenophora* на зернових,
- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* на рисі,

- *Pyricularia grisea* на дернині і зернових,
- *Pythium* spp. на дернині, рисі, кукурудзі, бавовнику, рапсі, соняшнику, цукровому буряку, овочах і інших рослинах (наприклад, *P. ultimum* або *P. anidematum*),

- *Ramularia collo-cygni* (рамуляріоз/сонячно-опіковий комплекс/фізіологічні опіки листя) на ячмені,

- види *Rhizoctonia* (наприклад, *R. solani*) на бавовнику, рисі, картоплі, дернині, кукурудзі, рапсі, цукровому буряку, овочах і інших рослинах, наприклад, *Rhizoctonia solani* (коренева/стеблова гнилізна) на соєвих бобах або *Rhizoctonia cerealis* (гострокінцева очна плямистість) на пшениці або ячмені,

- *Rhynchosporium secalis* на ячмені (листяна плямистість), житі і тритикалі,

- *Sclerotinia* види на рапсі, соняшнику і інших рослинах, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum* (захворювання стебла) або *Sclerotinia rolfsii* (захворювання стебла) на соєвих бобах,

- *Septoria glycines* (листяна плямистість) на соєвих бобах,

- *Septoria tritici* і *Stagonospora nodorum* на пшениці,

- *Erysiphe* (син. *Uncinulanecator*) на виноградній лозі,

- *Setosphaeria* види на кукурудзі і дернині,

- *Sphacelotheca reilina* на кукурудзі,

- *Stagonospora nodorum* (септорій колосся) на пшениці,

- *Thievaliopsis* види на соєвих бобах і бавовнику,

- *Tilletia* види на зернових,

- *Typhula incarnata* (снігова гнилізна) на пшениці або ячмені,

- *Ustilago* види на зернових, кукурудзі і цукровому буряку і

- *Venturia* види (парша) на яблунях і грушах (наприклад, *V. inaequalis* на яблунях).

Крім того, сполуки формули I придатні для боротьби зі шкідливими грибами при захисті матеріалів (наприклад, дерева, паперу, дисперсій для фарбування, волокон відповідно тканин) і при захисті запасів. При захисті деревини особливо враховують наступні шкідливі гриби:

Аскоміцети, такі як *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; базидіоміцети, такі як *Coniophora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. і *Tyromyces* spp., дейтероміцети, такі як *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichoderma* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces* spp. і зигоміцети, такі як *Mucor* spp., крім цього для захисту матеріалів наступні дріжджові гриби: *Candida* spp. і *Saccharomyces cerevisiae*.

Сполуки формули I застосовують таким чином, що гриби або рослини, посівний матеріал, матеріали або ґрунт, що підлягають захисту від ураження грибами обробляють фунгіцидною активною кількістю діючих речовин. Застосування може бути здійснене як перед, так і після ураження грибами матеріалів, рослин або насіння.

Фунгіцидні засоби, загалом, містять від 0,1 до 95, переважно від 0,5 до 90 мас.-% діючої речовини.

Норми витрати при застосуванні для захисту рослин в залежності від виду бажаного ефекту знаходяться між 0,01 і 2,0 кг діючої речовини на га.

При обробці посівного матеріалу, загалом, є необхідними кількості діючої речовини від 1 до 1000 г/100 кг, переважно від 5 до 100 г/100 кг посівного матеріалу.

При застосуванні для захисту матеріалів, відповідно захисту запасів норми витрати діючої речовини залежать від виду галузі застосування і бажаного ефекту. Звичайні норми витрати при захисті матеріалів, складають, наприклад, від 0,001 г до 2 кг, переважно від 0,005 г до 1 кг діючої речовини на кубічний метр матеріалу, що обробляють.

Сполуки формули I можуть знаходитися в різних кристалічних модифікаціях, які можуть різнитися своєю біологічною ефективністю. Вони рівним чином є об'єктом даного винаходу.

Сполуки формули I можуть бути переведені в звичайні композиції, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, тонкі порошки, порошки, пасти і грануляти. Форма застосування залежить від відповідної мети використання; в будь-якому випадку вона повинна забезпечувати тонкий і рівномірний розподіл сполуки відповідно до винаходу.

Композиції приготують відомим чином, наприклад, розведенням діючої речовини розчинниками й/або носіями, за бажанням із застосуванням емульгаторів і диспергаторів. Як розчинники / допоміжні речовини в основному придатні:

- вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти Solvesso, ксилол), парафіни (наприклад, фракції сирої нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гамма-бутиролактон), піролідони (N-метилпіролідон, N-октилпіролідон), ацетати (глікольдіацетат), гліколи, амідиметиллових кислот жирного ряду, кислоти жирного ряду й складні ефіри кислот жирного ряду. У принципі також можуть застосовуватися суміші розчинників,

- носії, такі як природні гірські породи (наприклад, каоліни, глинозем, тальк, крейда) і синтетич-

ні гірські породи (наприклад, високодисперсна кремнієва кислота, силікати); емульгатори, такі як неіоногенні й аніонні емульгатори (наприклад, прості ефіри поліоксиметиленових спиртів жирного ряду, алкілсульфонати й арилсульфонати) і диспергатори, такі як лігнінсульфітні відпрацьовані луги й метилцелюлоза.

Як поверхнево-активні речовини придатні лужні, лужноземельні, амонієві солі лігнінсульфокислоти, нафталінсульфокислоти, фенолсульфокислоти, дибутілнафталінсульфокислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати спиртів жирного ряду, жирні кислоти й сульфатовані гліколеві ефіри спиртів жирного ряду, далі продукти конденсації сульфонованого нафталіну й похідних нафталіну з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну або нафталінсульфокислоти з фенолом і формальдегідом, поліоксіетилен-октилфенольний ефір, етоксильований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенольний полігліколевий ефір, трибутилфенілполігліколевий ефір, тристерилфенілполігліколевий ефір, алкіларил-поліефірні спирти, конденсати окису етилену спирту жирного ряду, етоксильована рицинова олія, поліоксіетилен-алкіловий ефір, етоксильований поліоксипропілен, поліглікольєфірний ацетат лаурилових спиртів, складний ефір сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луги й метилцелюлоза.

Для одержання розчинів, що розприскують безпосередньо, емульсій, паст або масляних дисперсій придатні фракції мінеральних масел із середньої до високої крапками кипіння, такі як гас або дизельна олива, далі кам'яновугільні масла, а також олії рослинного або масла тваринного походження, аліфатичні, циклічні й ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їхні похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

Порошки, препарати для розпилення й опудрування можна одержати за допомогою змішування або спільного розмелу діючих речовин із твердим носієм.

Грануляти, наприклад, покриті, просочені або гомогенні, можуть бути отримані за допомогою сполуки діючих речовин із твердим носієм. Твердими носіями є, наприклад, мінеральні землі, такі як силікагелі, силікати, тальк, каолін, атаклей, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію й сульфат магнію, оксид магнію, розмелені синтетичні речовини, добрива, такі як наприклад, сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини й рослинні продукти, такі як борошно зернових культур, борошно деревної кори, деревне борошно й борошно горіхової шкарлупи, целюлозний порошок або інші тверді носії.

У загальному композиції містять, від 0,01 до 95мас.-%, переважно від 0,1 до 90мас.-% діючої речовини. При цьому діючі речовини використовуються із чистотою від 90% до 100%, переважно від 95% до 100% (відповідно до спектра ЯМР).

Приклади композицій: 1. Продукти для розведення в воді

А Водорозчинні концентрати (SL, LS)

10мас. част, діючих речовин розчиняють з 90мас. частин води або з водорозчинним розчинником. Альтернативно додають змочувальний агент або інші допоміжні агенти. При розведенні у воді діюча речовина розчиняється. Таким чином, одержують композицію з вмістом діючої речовини 10мас.-%.

В Здатні до диспергування концентрати (DC)

20мас. част, діючих речовин розчиняють в 70мас. частин циклогексанону при додаванні 10мас. частин диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. При розведенні у воді одержують дисперсію. Вміст діючої речовини становить 20мас.-%.

С Здатні до емульгування концентрати (EC)

15мас. част, діючих речовин розчиняють в 75мас. частин ксилолу при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію й етоксилату рицинової олії (по 5мас. частин). При розведенні у воді утворюється емульсія. Композиція містить 15мас.-% діючої речовини.

D Емульсії (EW, EO, ES)

25мас. част, діючих речовин розчиняють в 35мас. частин ксилолу при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію й етоксилату рицинової олії (по 5мас. частин). Цю суміш за допомогою емульгувального пристрою (наприклад, Ultraturax) вводять в 30мас. частин води й доводять до гомогенної емульсії. При розведенні у воді утворюється емульсія. Композиція містить 25мас. % діючої речовини.

E Суспензії (SC, OD, FS)

20мас. част, діючих речовин при додаванні 10мас. частин диспергатора й змочувального агента й 70мас. частин води або органічного розчинника подрібнюють у кульовому млині з мішалкою до тонкої суспензії діючої речовини. При розведенні у воді утворюється стабільна суспензія діючої речовини. Вміст діючої речовини в композиції становить 20мас. %.

F Здатні до диспергування у воді й водорозчинні грануляти (WG, SG)

50мас. част, діючих речовин тонко подрібнюють при додаванні 50мас. частин диспергатора й змочувального агента й за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзійного пристрою, розпилювальної башти, псевдорозрідженого шару) одержують здатний до диспергування у воді або водорозчинний гранулят. При розведенні у воді утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої речовини. Композиція містить 50мас. % діючої речовини.

G Здатні до диспергування у воді й водорозчинні порошки (WP, SP, SS, WS) 75мас. част, діючих речовин перемелюються при додаванні 25мас. частин диспергатора й змочувального агента, а також силікагелю в роторно-статорному млині. При розведенні у воді утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої речовини. Вміст діючої речовини в композиції становить 75мас. %.

H Гелеві композиції (GF)

У кульовому млині перемелюють 20мас. частин сполуки I відповідно до винаходу, 10мас. час-

тин диспергатора, 1мас. частину желювального агента і 70мас. частин води або органічного розчинника до утворення тонкої суспензії. При розведенні водою одержують стабільну суспензію з вмістом діючої речовини в 20мас. частин.

2. Продукти для безпосереднього нанесення I Порошки (DP, DS)

5мас. частин діючих речовин тонко подрібнюють і ретельно перемішують з 95мас. частин тонкодисперсного каоліну. Внаслідок чого одержують засіб для обпилення з вмістом діючої речовини 5мас. %.

J Грануляти (GR, FG, GG, MG)

0,5мас. частини діючих речовин тонко подрібнюють і зв'язують із 99,5мас. частин носія. При цьому звичайним способом є екструзія, розпилювальне сушіння або псевдорозріджений шар. Внаслідок чого одержують грануляти для безпосереднього застосування з вмістом діючої речовини 0,5мас. %.

K ULV-розчини (UL)

10мас. частин діючих речовин розчиняють в 90мас. частин органічного розчинника, наприклад, ксилолу. Внаслідок чого одержують продукт для безпосереднього застосування з вмістом діючої речовини 10мас. %.

Для обробки посівного матеріалу звичайно застосовують водорозчинні концентрати (LS), суспензії (FS), порошки (DS), порошки, що диспергуються у воді й водорозчинні порошки (WS, SS), емульсії (ES), здатні до емульгування концентрати (EC) і гелеві композиції (GF). Ці композиції можуть застосовуватися на посівний матеріал нерозбавленими або, переважно, розведеними. Застосування може здійснюватися перед посівом.

Діючі речовини можуть застосовуватися як такі, у формі своїх композицій або в приготовлених з них формах застосування, наприклад, використатися у формі розчинів призначених для безпосереднього обприскування, порошоків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, препаратів для обпилювання, препаратів для опудрювання або гранулятів і можуть застосовуватися шляхом обприскування, обпилювання, опудрювання або поливу. Форми застосування залежать від мети використання; у всякому разі повинне бути забезпечене максимально тонкий і рівномірний розподіл діючих речовин відповідно до винаходу.

Водні композиції можуть бути приготовлені з концентратів емульсій, паст або порошоків, що змочують, (порошки для розпилення, олійні дисперсії) за допомогою додавання води. Для одержання емульсій, паст або олійних дисперсій речовини як такі або розчинені в олії або розчиннику можуть гомогенізуватися у воді за допомогою змочувальних агентів, адгезійних сполук, диспергаторів або емульгаторів. Також можуть бути отримані концентрати, що складаються з активної речовини й змочувальних агентів, адгезійних сполук, диспергаторів або емульгаторів і можливо розчинника або олії, які придатні для розведення водою.

Концентрації діючих речовин у готових до застосування композиціях можуть варіюватися в широкому діапазоні. Загалом, такій концентрації

становлять від 0,0001 і до 10%, переважно від 0,01 до 1%.

Також діючі речовини можуть із великим успіхом використатися в способі з низькими об'ємами застосування Ultra-Low-Volume (ULV), причому можливо застосування композицій з більш ніж 95мас. % діючої речовини або навіть діючої речовини без добавок.

До діючих речовин можуть домішуватися олії різних типів, змочувальні агенти, добавки, гербіциди, фунгіциди, інші засоби для боротьби з патогенними грибами, бактерициди, також якщо буде потреба, безпосередньо перед застосуванням (суміш у баку). Ці засоби можуть домішуватися до засобів відповідно до винаходу у ваговому співвідношенні 1:100 до 100:1, переважно 1:10 до 10:1.

Як добавки в цьому контексті особливо придатні: органічно модифіковані полісилоксани, наприклад Break Thru S 240®; алкоксилати спирту, наприклад, Atplus 245®, Atplus MBA 1303®, Plurafac LF 300® і Lutensol ON 30®; EO-ПО-блокполімеризати, наприклад, Pluronic RPE 2035® і Genapol B®; етоксилати спирту, наприклад, Lutensol XP 80®; і діоктилсульфосукцинат натрію, наприклад, Leophen RA®.

Засоби відповідно до винаходу можуть знаходитися у формах застосування як фунгіциди разом з іншими діючими речовинами, наприклад, з гербіцидами, інсектицидами, регуляторами росту, фунгіцидами або також з добривами. При змішуванні сполук і або засобів, що їх містять, в формі застосування як фунгіцидів з іншими фунгіцидами в більшості випадків одержують збільшення фунгіцидного спектра дії.

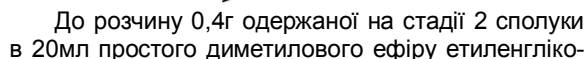
Наступний перелік фунгіцидів, разом з якими можуть застосовуватися діючі речовини згідно з винаходом, повинен пояснити комбінаційні можливості, але не обмежити їх:

Стробілурини

азоксистробін, димоксистробін, енестробури, флуоксастробін, крезоксим-метил, метоміностробін, пікоксистробін, піраклостробін, трифлуксистробін, оризастробін, складний метиловий ефір (2-хлор-5-[1-(3-метил-бензилоксиіміно)-етил]-бензил)-карбамінової кислоти, складний метиловий ефір (2-хлор-5-[1-(6-метил-піридин-2-илметоксиіміно)-етил]-бензил)-карбамінової кислоти, складний метиловий ефір 2-(орто-(2,5-диметилфеніл-оксиметил)феніл)-3-метоксиакрилової кислоти;

Аміди карбонової кислоти

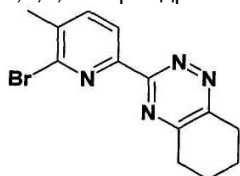
- аніліди карбонової кислоти: беналаксил, беноданіл, боскалід, карбоксин, мепроніл, фенфурам, фенгексамід, флутоланіл, фураметпір, металаксил, офураце, оксидиксил, оксикарбоксин, пентіопірад, тифлузамід, тіадиніл, (4'-бром-біфеніл-2-іл)-амід 4-дифторметил-2-метил-тіазол-5-карбонової кислоти, (4'-трифторметил-біфеніл-2-іл)-амід 4-дифторметил-2-метил-тіазол-5-карбонової кислоти, (4'-хлор-3'-фтор-біфеніл-2-іл)-амід 4-дифторметил-2-метил-тіазол-5-карбонової кислоти, (3',4'-дихлор-4-фтор-біфеніл-2-іл)-амід 3-дифторметил-1-метил-піразол-4-карбонової кислоти, (2-ціано-феніл)-амід 3,4-дихлор-ізотіазол-5-карбонової кислоти;



лю додають по черзі 0,21г 4-фторфенілборної кислоти, і 0,41г карбонату натрію в 20мл води. Після додавання приблизно 30мг дихлориду [1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан]-палладію(II) перемішують 5 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин був розподілений між водою і МтБЕ. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують на силікагелі за допомогою циклогексану/МтБЕ (1:1). Таким чином, одержують 0,24г продукту. Тпл. 108°C

Приклад 2: 3-[6-(4-фторфеніл)-5-метилпіридин-2-іл]-5,6,7,8-тетрагідробензо-[1,2,4]-тріазину

1) Одержання 3-(6-бром-5-метилпіридин-2-іл)-5,6,7,8-тетрагідробензо-[1,2,4]-тріазину

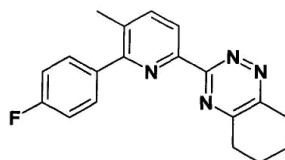


До розчину 10г (40ммоль) гідрохлориду 6-бром-5-метилпіридин-2-карбоксамідину в 100мл етанолу (EtOH) додають 2,4г (48ммоль) гідроксиду гідразинію. Через 30хв. змішують з 4,5г (40ммоль) циклогексан-1,2-діону і перемішують 7 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин був розподілений між водою і МтБЕ, органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують на силі-

кагелі за допомогою циклогексану/МтБЕ (1:1) і МтБЕ/EtOH (1:1). Вихід: 5,5г продукту.

¹H-NMR (δ, CDCl₃): 1,9 (m); 2,5 (s); 2,8 (m); 3,1 (m); 3,2 (m); 7,7 (m) і 8,45 (m).

2) Одержання 3-[6-(4-фторфеніл)-5-метилпіридин-2-іл]-5,6,7,8-тетрагідробензо-[1,2,4]-тріазину



До розчину 0,4г одержаної на стадії 1 сполуки в 20мл простого диметилового ефіру етиленгліколю додають по черзі 0,22г 4-фторфенілборної кислоти і 0,41г карбонату натрію в 20мл води. Після додавання приблизно 30мг дихлориду [1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан]-палладію(II) перемішують 5 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин був розподілений між водою і МтБЕ. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують на силікагелі за допомогою циклогексану/МтБЕ (1:1). Таким чином, одержують 0,13г продукту.

Тпл. 105°C

Аналогічним чином були одержані описані в таблиці 1 сполуки загальної формули I:

Таблиця 1:

№	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Фіз. данні (°C)/[M+H] ⁺
1	4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	108
2	4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		105
3	4-фтор-феніл	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	112-115
4	феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	70-73
5	4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	151-154
6	феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	193-196
7	3,4-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	139-142
8	3,4,5-трифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	169
9	3,5-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	158
10	3-хлор-4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	120
11	3-метил-4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	154
12	4-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	133-137
13	4-метил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	128-130
14	4-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	118-120
15	4-ціано-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	171-173
16	4-форміл-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	122-124
17	4-трет.-бутил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	97-101
18	4-ізо-пропіл-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	100-103
19	4-трифторметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	131-137
20	2-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-106
21	2-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	129-132
22	2-метил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-120
23	2,4-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	142-144
24	3-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	95-98
25	3-метил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	61-64
26	3-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	масло
27	4-ацетил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	124-126

28	4-етокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-107
29	3,4-диметокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	99-102
30	3,5-дихлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	146-148
31	феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		161
32	4-фтор-феніл	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		140-143
33	3-хлор-4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	124-128
34	4-феноксифеніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-128
35	4-тиометил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	123-126
36	3,4-дихлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	145-148
37	3-хлор-4-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	127-130
38	3-фтор-4-етокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	96-99
39	3,5-диметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333
40	3-хлор-4-ізо-пропокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 397
41	3-хлор-4-етокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	116-119
42	2-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	97-100
43	3-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 323
44	3-етокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	89-92
45	3-фтор-4-метокси	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	117-120
46	3,4-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	121-124
47	4-етил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	102-106
48	3,5-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	111-113
49	3-ізопропокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 363,2
50	2,3-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-117
51	2,5-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-118
52	2,5-дихлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	117-120
53	3-метил-4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	92-95
54	2,4-диметокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 365,2
55	2,3-диметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-130
56	2,5-диметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333,2
57	2-етокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	89-96
58	4-трифторметокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-117
59	3,4,5-трифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	157-160
60	4-п-пропокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-115
61	3-фтор-4-метил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	119-122
62	4-ізо-пропокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	91-95
63	4-п-бутоксифеніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 377,2
64	4-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		165-168
65	2-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		175-178
66	2-метил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		156-159
67	2,4-дифтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-145
68	2,4-дихлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		173-176
69	4-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		159-163
70	2-метокси-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		144-147
71	2-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		148-152
72	2,3-диметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-145
73	2-етил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		140-142
74	2-трифторметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		163-166
75	4-трифторметил-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		155-158
76	2-метил-4-фтор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 337,3
77	3-метил-4-метокси	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	101-108
78	3-метил-4-хлор-феніл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	105-109
79	тіофен-2-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	141-144
80	4-метил-тіофен-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	98-102
81	6-фтор-піридин-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	126-129
82	піридин-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	93-97
83	6-метокси-піридин-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-117
84	2-хлор-піридин-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	93-99
85	6-хлор-піридин-3-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	143-147
86	піридин-4-іл	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	127-130

Перевірка фунгіцидної дії:

Діючі речовини окремо або разом готували як основний розчин з 25мг діючої речовини, який доводили до 10мл сумішшю з ацетону і/або диметилсульфоксиду (ДМСО) і емульгатору Wettol® EM 31 (змочувальний агент з емульгувальною і диспергувальною дією на основі етоксильованих алкілфенолів) в об'ємному співвідношенні розчинника і емульгатора 99:1. Потім розчин доводили водою до 100мл. Цей основний розчин розводили описаною сумішшю розчинника емульгатора і води до зазначеної нижче концентрації діючої речовини.

Приклад застосування 1 - Дія проти бурі плямистості томатів, викликані *Alternaria solani*

Листя вирощених в горщиках рослин томату обприскували до утворення крапель водною суспензією в нижченаведеній концентрації діючої речовини. Наступного дня оброблені рослини інфікували суспензією спор *Alternaria solani*, що містить $0,17 \times 10^6$ спор/мл в 2%-ому водному розчині біосолоду. Потім дослідні рослини поміщали в насичену водяною парою камеру при температурі від 20 до 22°C. Через 5 днів на необроблених, інфікованих дослідних рослинах розвинулась настільки сильно, що ступінь ураження можна визначити візуально в %.

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн. част, діючих речовин з прикладів 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11 або 33 показали максимальне ураження в 5%, в той час як необроблені рослини були уражені на 90%.

Приклад застосування 2 - Дія проти сірої гнилизни на листі паприки, викликані *Botrytis cinerea* при 1-денному захисному застосуванні

Листя паприки сорту "Neusiedler Ideal Elite" після того, як добре розвинулись 2-3 листка, обприскували до утворення крапель водною суспензією в наведеній нижче концентрації діючої речовини. Наступного дня оброблені рослини інокулювали суспензією спор *Botrytis cinerea*, що містить $1,7 \times 10^6$ спор/мл в 2%-ому водному розчині біосолоду. Потім дослідні рослини поміщали в темну кліматичну камеру при температурі між 22 і 24°C, і високій вологості повітря. Через 5 днів об'єм ураження грибами на листі визначали візуально в %.

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн. част, діючих речовин з прикладів 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 31 або 33 показали максимальне ураження в 10%, в той час як необроблені рослини були уражені на 90%.

Приклад застосування 3 - Дія проти сітчастої плямистості ячменю, викликані *Puccinia teres* при 1-денному захисному застосуванні

Листя вирощених в горщиках паростків ячменю обприскували до утворення крапель водною суспензією в наведеній нижче концентрації діючої речовини. Через 24 години після підсихання наприсканого шару дослідні рослини інокулювали водною суспензією спор *Puccinia teres* [син. *Drechslera*] *teres*, збудником сітчастої плямистості. Потім дослідні рослини поміщали в теплицю при температурі від 20 до 24°C і відносній вологості повітря від 95 до 100%. Через 6 днів ступінь розвитку захворювання визначали візуально в % ураження загальної поверхні листя.

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн. част, діючої речовини з прикладу 31 показали максимальне ураження в 10%, в той час як необроблені рослини були уражені на 90%.