



УКРАЇНА

(19) UA (11) 70991 (13) C2

(51) 7 C07C233/37, C07D333/58,

285/00, 273/00, C07C251/04,

A01N37/52, 43/82

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

(54) ПОХІДНІ N2-ФЕНІЛАМІДИНУ, ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ТА ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ

1

2

(21) 2001096140

(22) 04.02.2000

(24) 15.11.2004

(86) PCT/GB00/00345, 04.02.2000

(31) 9902592.6

(32) 06.02.1999

(33) GB

(46) 15.11.2004, Бюл. № 11, 2004 р.

(72) Чарлес Марк Девід, GB, Франк Уілфред, DE,
Грін Девід Ерік, GB, Хаф Томас Лавлі, GB, Мітчелл
Дейл Роберт, GB, Сімпсон Дональд Джеймс, GB,
Атералл Джон Фрідерік, GB

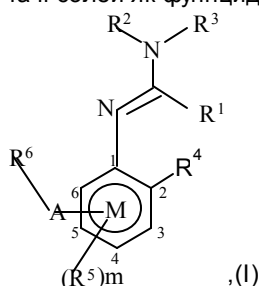
(73) АВЕНТИС КРОПСАЙНС ГМБХ, DE

(56) US 4209319, A, 1980

DE 4405614, A1, 1995

US 3284289, A, 1966

EP 0429281, A2, 1990

(57) 1. Застосування сполуки загальної формули I
та її солей як фунгіцидів

де

R¹ - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гете-
роцикліл, кожний з яких може бути заміщеним, або
водень;R² і R³, які можуть бути однаковими або різними,
являють собою будь-яку групу, визначену для R¹;
ціаногрупу; ацил; -OR^a або -SR^a, де R^a - алкіл,
алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл,
кожний з яких може бути заміщеним; або R² і R³
або R² і R¹ разом з атомами, які їх з'єднують, мо-
жуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним;
R⁴ являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл
або гетероцикліл, кожний з яких може бути замі-
щеним; гідроксильну групу; меркаптогрупу; азидо-
групу; нітрогрупу; галоген; ціаногрупу; ацил; не-
обов'язково заміщену аміногрупу; ціаногрупу;
тіоціаногрупу; -SF₅;-OR^a, -SR^a або -Si(R^a)₃;

m приймає значення від 0 до 3;

коли наявні R⁵, які можуть бути однаковими або
різними, вони приймають значення, вказані для R⁴;
R⁶ - необов'язково заміщений карбо- або гетеро-
цикліл; і A - безпосередній зв'язок,-O-, -S(O)_n-, -NR⁹-, -CR⁷=CR⁷-, -C≡C-, -A¹-

, -A¹-A¹-, -O-(A¹)_k-O-, -O-(A¹)_k-, -A³-, -A⁴-, -A¹O-, -A¹S(O)_n-, -A²-, OA²-, -NR⁹A²-, -
OA²-A¹-, -OA²-C(R⁷)=C(R⁸)-, -S(O)_nA¹-, -A¹-A⁴-, -A¹-A⁴-C(R⁸)=N-N=CR⁸-, -A¹-A⁴-
C(R⁸)=N-X²-X³-, -A¹-A⁴-A³-, -A¹-A⁴-N(R⁹)-, -A¹-A⁴-X-CH₂-, -A¹-A⁴-A¹-, -A¹-A⁴-CH₂X-,
-A¹-A⁴-C(R⁸)=N-X²-X³-X¹-, -A¹-X-C(R⁸)=N-, -A¹-X-C(R⁸)=N-N=CR⁸-, -A¹-X-C(R⁸)=N-
N(R⁹)-, -A¹-X-A²-X¹-, -A¹-O-A³-, -A¹-O-C(R⁷)=C(R⁸)-, -A¹-O-N(R⁹)-A²-N(R⁹)-, -A¹-O-
N(R⁹)-A²-, -A¹-N(R⁹)-A²-N(R⁹)-, -A¹-N(R⁹)-A²-, -A¹-N(R⁹)-N=C(R⁸)-, -A³-A¹-, -A⁴-A³-, -
A²-NR⁹-, -A¹-A²-X¹-, -A¹-A¹-A²-X¹-, -O-A²-N(R⁹)-A²-, -CR⁷=CR⁷-A²-X¹-, -C≡C-A²-X¹-,
-N=C(R⁸)-A²-X¹-, -C(R⁸)=N-N=C(R⁸)-, -C(R⁸)=N-N(R⁹)-, - (CH₂)₂-O-N=C(R⁸)- або -X-
A²-N(R⁹)-,

де

(13) C2

(11) 70991

(19) UA

n дорівнює 0, 1 або 2,

k приймає значення від 1 до 9,

A^1 - $-\text{CHR}^7-$,

A^2 - $-\text{C}(=\text{X})-$,

A^3 - $-\text{C}(\text{R}^8)=\text{N}-\text{O}-$,

A^4 - $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^8)-$,

X - O або S ,

X^1 - O , S , NR^9 або безпосередній зв'язок,

X^2 - O , NR^9 або безпосередній зв'язок,

X^3 - водень, $-\text{C}(=\text{O})-$, $-\text{SO}_2-$ або безпосередній зв'язок,

R^7 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою алкіл, циклоалкіл або феніл, кожний з яких може бути заміщеним; або водень, галоген, ціаногрупу або ацил;

R^8 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, алкілтіогрупу, карбо- або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним;

або являють собою водень;

R^9 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений карбо- або гетероцикліл, водень або ацил; або дві групи R^9 на A разом із з'єднуючими їх атомами утворюють 5-7-членне кільце; де фрагмент, зображений на правій стороні сполучної групи A , приєднаний до R^6 , або $-\text{AR}^6$ і R^5 разом з бензольним кільцем M утворюють необов'язково заміщену конденсовану кільцеву систему.

2. Застосування за п. 1, де R^1 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом; або являє собою водень.

3. Застосування за п. 1, де R^1 - $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ алкіл або водень.

4. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою алкіл, алкеніл, алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном, необов'язково заміщеним фенілом; або являють собою водень; алкоксигрупу; алкоксіалкоксигрупу; бензилоксигрупу; ціаногрупу або алкілкарбоніл.

5. Застосування за п. 4, де R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ алкіл або водень.

6. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^4 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом; або являє собою гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу або алкілтіогрупу.

7. Застосування за п. 6, де R^4 - $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ алкіл або галоген.

8. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де m дорівнює 0 або 1.

9. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^5 , коли є присутнім, є групою, що визначена для R^4 у пункті 6.

10. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де група R^5 , коли вона присутня, приєднана в положенні 5 кільця M .

11. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де A - безпосередній зв'язок, $-\text{O}-$, $-\text{S}(\text{O})_n\text{A}^1-$, $-\text{O}(\text{A}^1)_k-$, $-\text{S}(\text{O})_n-$, $-\text{NR}^9\text{A}^2-$, $-\text{A}^2-$, $-\text{OA}^2-$, $-\text{OA}^2\text{-A}^1-$, $-\text{NR}^9$ або $-\text{O}(\text{A}^1)_k\text{O}-$.

12. Застосування за п. 11, де A - безпосередній зв'язок, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{NR}^9-$, $-\text{CHR}^7-$ або $-\text{O}-\text{CHR}^7-$.

13. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^9 , коли присутній, - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном чи необов'язково заміщеним фенілом; або являє собою водень.

14. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^7 , коли присутній, являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном чи необов'язково заміщеним фенілом; або являє собою гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу; алкілтіогрупу або водень.

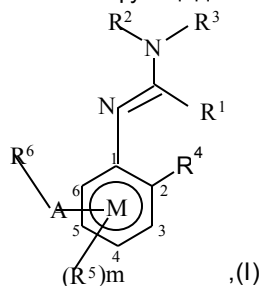
15. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де A приєднаний у положенні 4 бензольного кільця M .

16. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^6 - необов'язково заміщений феніл або необов'язково заміщений ароматичний гетероцикліл.

17. Застосування за будь-яким попереднім пунктом, де R^6 , коли є заміщеним, може бути заміщений одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути вибрані з такого переліку: алкіл, алкеніл, алкініл, карбо- або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; гідроксильна група; меркаптогрупа; азидогрупа; нітрогрупа; галоген; ціаногрупа; ацил; необов'язково заміщена аміногрупа; ціанатогрупа; тіоціанатогрупа; $-\text{SF}_5-$; $-\text{OR}^a$; $-\text{SR}^a$ і $-\text{Si}(\text{R}^a)_3$, де R^a - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним.

18. Застосування за п. 17, де R^6 , коли є заміщеним, може бути заміщений одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути вибрані з такого переліку: гідроксильна група; галоген; ціаногрупа; ацил; аміногрупа; алкіламіногрупа; діалкіламіногрупа; алкіл; галогеналкіл; R^aO -алкіл; ацилоксіалкіл; ціанооксіалкіл; алкоксигрупа; галогеналкоксигрупа; алкілтіогрупа; карбоцикліл, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; і бензил, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галоалкоксигрупою або алкілтіогрупою.

19. Застосування сполуки загальної формули I і її солей як фунгіцидів



R^1 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або являє собою водень;
 R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, приймають значення, вказані для R^1 , або являють собою алкоксигрупу, алкоксіалкоксигрупу, бензил-оксигрупу, ціаногрупу або алкілкарбоніл;
 R^4 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або являє собою гідроксильну групу, галоген; ціаногрупу або ацил;
 m дорівнює 0 або 1;
 R^5 , коли є присутнім, приймає значення, вказані для R^4 ;

A - безпосередній зв'язок; -O-; -S-; -NR⁹-, -CHR⁷- або -O-CHR⁷-;

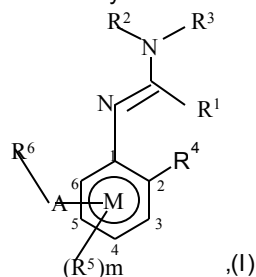
де R^9 , коли є присутнім, являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або являє собою водень;

і R^7 приймає значення, вказані для R^9 , або являє собою гідроксильну групу, галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу або алкілтіогрупу;

A приєднаний у положенні 4 бензольного кільця M; а

R^6 - феніл або ароматичний гетероциклі, необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути вибрані з такого переліку: гідроксильна група; галоген; ціаногрупа; ацил; аміногрупа; алкіламіногрупа; діалкіламіногрупа; алкіл; галогеналкіл; R^a O-алкіл; ацилоксіалкіл; ціанооксидалкіл; алкоксигрупа; галогеналкоксигрупа; алкілтіогрупа; карбоциклі, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; і бензил, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою.

20. Сполука загальної формули I та її солі



де

R^1 - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоциклі або гетероциклі, кожний з яких може бути заміщеним, або являє собою водень;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, приймають значення, вказані для R^1 , або разом з

нітрогеном, до якого вони приєднані, можуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним;

R^4 - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоциклі або гетероциклі, кожний з яких може бути заміщеним; m дорівнює 1;

R^5 приймає значення, вказані для R^4 , і приєднаний у положенні 5 бензольного кільця M;

R^6 - необов'язково заміщений карбо- або гетероциклі; і

A - безпосередній зв'язок; -O-; -S-; -NR⁹-, де R^9 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом;

-CHR⁷- або -O-CHR⁷-, де R^7 - алкіл, алкеніл або алкініл, які можуть бути заміщені алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; або являє собою гідроксильну групу, галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу або алкілтіогрупу;

де -A- R^6 знаходиться в положенні 4 бензольного кільця M і фрагмент, зображений з правої сторони сполучної групи A, приєднаний до R^6 ;

або -A- R^6 і R^5 разом з бензольним кільцем M утворюють необов'язково заміщену конденсовану кільцеву систему.

21. Сполука за п. 20, яка відрізняється тим, що:

R^1 - алкіл або водень,

R^2 і R^3 , однакові або різні, являють собою водень, алкіл, алкеніл, карбоциклі,

R^4 - алкіл або алкеніл,

m дорівнює 1;

R^5 являє собою будь-яку групу, визначену для R^4 , приєднану до положення 5 бензольного кільця M;

R^6 - необов'язково заміщений карбо- або гетероциклі, та

A - безпосередній зв'язок; -O-; -S-; -NR⁹-, де R^9 - алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкокси, галоалкокси, алкілтіо, галоген або необов'язково заміщений феніл; -CHR⁷- або -O-CHR⁷-, де R^7 - алкіл, алкеніл або алкініл, який

може бути заміщений алкокси, галоалкокси, алкілтіо, галоген або феніл, необов'язково заміщений алкілом, галоалкілом, алкокси, галоалкокси або алкілтіо; або являє собою гідрокси; галоген; ціаногрупу; ацил; алкокси; галоалкокси; або алкілтіо;

де -A- R^6 знаходиться в положенні 4 бензольного кільця M і фрагмент, зображений з правої сторони сполучної групи A, приєднаний до R^6 ;

або -A- R^6 і R^5 разом з бензольним кільцем M утворюють необов'язково заміщену конденсовану кільцеву систему.

22. Сполука за п. 21, яка відрізняється тим, що

R^1 - водень,

R^2 і R^3 , однакові або різні, являють собою алкіл або алкеніл;

R^4 - алкіл,

m дорівнює 1;

R^5 являє собою будь-яку групу, визначену для R^4 , приєднану до положення 5 бензольного кільця M;

R^6 - необов'язково заміщений карбо- або гетероциклі; і

A - -O-;

де $-A-R^6$ знаходиться в положенні 4 бензольного кільця M і фрагмент, зображений з правої сторони сполучної групи A, приєднаний до R^6 .

23. Сполука за п. 20, яка являє собою:

N' -[4-(3-трет-бутилфенокси)-2,5-диметилфеніл]-N,N-диметилімідоформамід [b1],

N' -[4-(3-трет-бутилфенокси)-2,5-диметилфеніл]-N-етил-N-метилімідоформамід [SdLD2],

N-аліл- N' -[4-(3-трет-бутилфенокси)-2,5-диметилфеніл]-N-метилімідоформамід [SdLD3],

N' -[4-{[4-(2-хлорфеніл)-1,3-тіазол-2-іл]окси}-2,5-диметилфеніл]-N,N-

диметилімідоформамід [SdLD4],

N' -[2,5-диметил-4-(3-феноксифенокси)феніл]-N-етил-N-метилімідоформамід [SdLD5],

N' -[4-[4-хлоро-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфеніл]-N,N-

диметилімідоформамід [SdLD6],

N' -[4-[4-хлоро-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфеніл]-N-етил-N-

метилімідоформамід [SdLD7],

N' -[4-[3-(1-метокси-1-метилетил)фенокси]-2,5-диметилфеніл]-N,N-

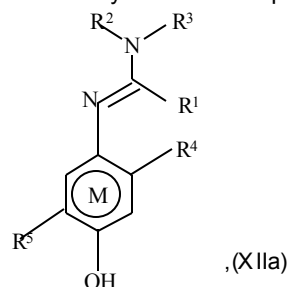
диметилімідоформамід [SdLD8],

N-етил- N' -[4-[4-фторо-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфеніл]-N-метилімідоформамід [SdLD9].

24. Фунгіцидна композиція, яка включає щонайменше одну сполуку за п. 20 в суміші з наповнювачем або носієм, прийнятним для сільськогосподарського застосування.

25. Спосіб знищення грибків в осередках зараження або на ділянках, доступних для зараження, який включає нанесення на осередок зараження сполуки за п.1.

26. Сполука загальної формули XIIa

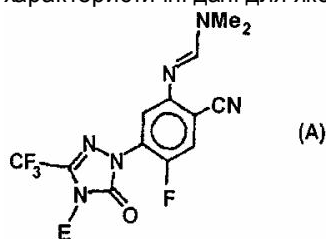


де R^1 - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним, або являє собою водень;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, приймають значення, вказані для R^1 , являють собою ціаногрупу; ацил; $-OR^a$ або $-SR^a$, де R^a - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; або R^2 і R^3 , або R^2 і R^1 разом із з'єднуючими їх атомами можуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним; R^4 - алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; і R^5 приймає значення, вказані для R^4 ; за умови, що R^5 не є трет-бутилом.

Цей винахід стосується застосування сполук в якості фунгіцидів.

Публікація WO 95/22532 стосується заміщених фенілтріазолінонів, заявлених в якості гербіцидів, і в ній, зокрема, патентується сполука формули A, характеристичні дані для якої відсутні.

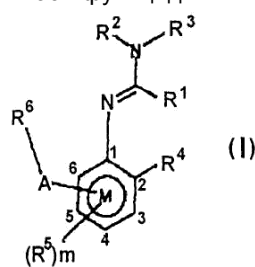


Реферат, заявлена композиція і заявлене застосування відносяться тільки до застосування таких сполук як гербіциди, і справді, опис підтверджує винахід тільки даними гербіцидної активності. В описі є пропозиція, у якій відзначено, що деякі сполуки виявляють фунгіцидну активність, хоч дані з фунгіцидній активності не наведені. Не зазначено, які сполуки є фунгіцидами, і немає підтвердження того, що сполука A могла б служити фунгіцидом.

У патенті США 3284289 описано спосіб захисту рослин від шкідливих грибків за допомогою феніламідинової сполуки.

Заявниками цього винаходу було встановлено, що деякі амідини мають фунгіцидну активність. Таким чином, цей винахід представляє застосу-

вання сполуки загальної формули I і її солей в якості фунгіцидів:



де R^1 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним, або гідроген;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, являють собою будь-яку групу, що визначена для R^1 ; ціаногрупу; ацил; $-OR^a$ або $-SR^a$, де R^a представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; або R^2 і R^3 або R^2 і R^1 разом з атомами, які їх з'єднують, можуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним;

R^4 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; гідроксильну групу; меркаптогрупу; азидогрупу; нітрогрупу; галоген; ціаногрупу; ацил; необов'язково заміщену аміногрупу; ціаногрупу; тіоціаногрупу; $-SF_5$; $-OR^a$; $-SR^a$ або $-Si(R^a)_3$;

m приймає значення від 0 до 3;

коли присутні R^5 , які можуть бути однаковими або різними, вони приймають значення, що визначені для R^4 ;

R^6 представляє необов'язково заміщений карбо- або гетероциклілі; і

A представляє безпосередній зв'язок, $-O-$, $-S(O)_n-$, $-NR^9-$, $-CR^7=CR^7-$, $-C\equiv C-$, $-A^1-$, $-A^1A^1-$, $-O-(A^1)_kO-$, $-O-(A^1)_k-$, $-A^3-$, $-A^4-$, $-A^{10}-$, $-A^1S(O)_n-$, $-A^2-$, OA^2- , $-NR^9A^2-$, $-OA^2A^1-$, $-OA^2C(R^7)=C(R^8)-$, $-S(O)_nA^1-$, $-A^1A^4-$, $-A^1A^4C(R^8)=N-N=CR^8-$, $-A^1A^4C(R^8)=N-X^2-X^3-$, $-A^1A^4A^3-$, $-A^1A^4N(R^9)-$, $-A^1A^4X-CH_2-$, $-A^1A^4A^1-$, $-A^1A^4CH_2X-$, $-A^1A^4C(R^8)=N-X^2-X^3-X^1-$, $-A^1X-C(R^8)=N-$, $-A^1X-C(R^8)=N-N=CR^8-$, $-A^1X-C(R^8)=N-N(R^9)-$, $-A^1X-A^2-X^1-$, $-A^1O-A^3-$, $-A^1O-C(R^7)=C(R^8)-$, $-A^1O-N(R^9)-A^2N(R^9)-$, $-A^1O-N(R^9)-A^2-$, $-A^1N(R^9)-A^2N(R^9)-$, $-A^1N(R^9)-A^2-$, $-A^1N(R^9)-N=C(R^8)-$, $-O^3A^1-$, $-A^4A^3-$, $-A^2NR^9-$, $-A^1A^2X^1-$, $-A^1A^1A^2X^1-$, $-O-A^2N(R^9)-A^2-$, $-CR^7=CR^7-A^2X^1-$, $-C\equiv C-A^2X^1-$, $-N=C(R^8)-A^2X^1-$, $-C(R^8)=N-N=C(R^8)-$, $-C(R^8)=N-N(R^9)-$, $-(CH_2)_2O-N=C(R^8)-$ або $-X-A^2N(R^9)-$,

де

n дорівнює 0, 1 або 2,

k приймає значення від 1 до 9,

A^1 представляє $-CHR^7-$,

A^2 представляє $-C(=X)-$,

A^3 представляє $-C(R^8)=N-O-$,

A^4 представляє $-O-N=C(R^8)-$,

X представляє O або S ,

X^1 представляє O , S , NR^9 або безпосередній зв'язок,

X^2 представляє O , NR^9 або безпосередній зв'язок,

X^3 представляє гідроген, $-C(=)-$, $-SO_2-$ або безпосередній зв'язок,

R^7 , які можуть бути однаковими або різними, представляють алкіл, циклоалкіл або феніл, кожний з яких може бути заміщеним; або гідроген, галоген, ціаногрупу або ацил;

R^8 , які можуть бути однаковими або різними, представляють алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупу, алкілтіогрупу, карбо- або гетероциклілі, кожний з яких може бути заміщеним; або представляють гідроген;

R^9 , які можуть бути однаковими або різними, представляють необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений карбо- або гетероциклілі, гідроген або ацил; або дві групи R^9 на A разом із з'єднуючими їх атомами утворюють 5-7-членне кільце;

де фрагмент, зображений на правій стороні сполучної групи A , приєднаний до R^6 ;

або $-AR^6$ і R^5 разом з бензольним кільцем M утворюють необов'язково заміщену конденсовану кільцеву систему.

Переважно R^1 представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою галогеном або необов'язково заміщеним фенілом (переважно фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону, або галогеном), або гідроген. Найкраще, R^1 представляє C_{1-10} алкіл (наприклад, метил) або гідроген.

Переважно, R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, представляють алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом (переважно фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону, або галогеном) або представляють гідроген, алкоксигрупу, алкоксіалкоксигрупу, бензилоксигрупу, ціаногрупу або алкілкарбоніл. Найкраще, R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, представляють C_{1-10} алкіл (наприклад, метил або етил) або гідроген.

Переважно, R^4 представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом (переважно фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону, або галогеном); або представляє гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил (переважно $-C(=O)R^C$, $-C(=S)R^C$ або $-S(O)PR^C$, де R^C представляє алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілтіогрупу, аміногрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або феніл, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою); алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу або алкілтіогрупу. Найкраще, R^4 представляє C_{1-10} алкіл (наприклад, метил або етил) або галоген.

Переважно, m дорівнює 0 або 1, найкраще, m дорівнює 1.

R^5 , коли є присутнім, переважно представляє групу, визначену вище для кращих значень R^4 . Найкраще, R^5 представляє C_{1-10} алкіл або галоген.

R^5 , коли є присутнім, переважно приєднаний у положенні 5 кільця M .

Переважно, A представляє безпосередній зв'язок, $-O-$, $-S(O)_nA^1-$, $-O(A^1)_k-$, $-S(O)_n-$, $-NR^9A^2-$, $-A^2-$, $-OA^2-$, $-OA^2A^1-$, $-NR^9-$ або $-O(A^1)_kO-$. Найкраще, A представляє безпосередній зв'язок, $-O-$, $-S-$, $-NR^9-$, $-CHR^7-$ або $-O-CHR^7-$. Ще краще, A представляє безпосередній зв'язок або $-O-$. R^9 , коли є присутнім, представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галоалкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом (переважно фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону, або галогеном); або представляє гідроген (найкраще, R^9 представляє C_{1-10} алкіл або гідроген). R^7 , коли є присутнім, представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або необов'язково заміщеним фенілом (переважно фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону, або галогеном); або представляє гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу, ацил; алкоксигрупу,

галогеналкоксигрупу; алкілтіогрупу або гідроген (найкраще, R^7 представляє C_1 - C_{10} алкіл або гідроген).

Переважно, А приєднаний у положення 4 бензольного кільця М.

Переважно, R^6 представляє необов'язково заміщений феніл або необов'язково заміщений ароматичний гетероцикліл [переважно, тiazоліл, іzотіазоліл, тіадіазоліл (найкраще 1,2,4-тіадіазоліл), піридил або піримідиніл].

Коли R^6 є заміщеним, він може бути заміщеним одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути обраними з кращого переліку: алкіл, алкеніл, алкініл, карбо- або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; гідроксильна група; меркаптогрупа; азидогрупа; нітрогрупа; галоген; ціаногрупа; ацил; необов'язково заміщена аміногрупа; ціаногрупа; тіоціаногрупа; $-SF_5$; $-OR^a$; $-SR^a$ і $-Si(R^a)_3$, де R^a представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним.

Кращими замісниками R^6 є: гідроксильна група; галоген; ціаногрупа; ацил (переважно $-C(=O)R^C$, $-C(=S)R^C$ або $-S(O)_pR^C$, де R^C представляє алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілтіогрупу, аміногрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або феніл, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою); аміногрупу; алкіламіногрупу; діалкіламіногрупу; алкіл; галогеналкіл; R^aO -алкіл; ацилоксилалкіл; ціанооксіалкіл; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу; алкілтіогрупу; карбоцикліл (переважно циклогексил або цикlopентил), необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; і бензил, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою.

Найкращими замісниками R^6 є: цикlopентил, циклогексил або бензил, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; або галоген; алкіл; галогеналкіл; алкоксіалкіл; гідроксіалкіл; алкоксигрупа або алкілтіогрупа.

У кращому втіленні винахід представляє застосування сполуки загальної формули I і її солей в якості фунгіцидів, де

R^1 представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або представляє гідроген;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, приймають значення, визначені для R^1 , або представляють алкоксигрупу, алкоксіалкоксигрупу, бензилоксигрупу, ціаногрупу або алкілкарбоніл;

R^4 представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або пред-

ставляє гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил (переважно $-C(=O)R^C$, $-C(=S)R^C$, $-S(O)_pR^C$, де R^C представляє алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілтіогрупу, аміногрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або феніл, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою);

m дорівнює 0 або 1;

R^5 , коли є присутнім, представляє групу, визначену для R^4 ;

А представляє безпосередній зв'язок, $-O-$, $-S-$, $-NR^9-$, $-CHR^7-$ або $-O-CHR^7-$, де R^9 , коли є присутнім, представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, необов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою або галогеном; або представляє гідроген; і R^7 представляє групу, визначену для R^9 , або гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу або алкілтіогрупу;

А приєднаний у положенні 4 бензольного кільця М; а

R^6 представляє феніл або ароматичний гетероцикліл, необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути обраними з такого переліку: гідроксильна група; галоген; ціаногрупа; ацил (переважно $-C(=O)R^C$, $-C(=S)R^C$ або $-S(O)_pR^C$, де R^C представляє алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупу, галогеналкоксигрупу, алкілтіогрупу, аміногрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або феніл, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою); аміногрупа; алкіламіногрупа; діалкіламіногрупа; алкіл; галогеналкіл; R^aO -алкіл; ацилоксіалкіл; ціанооксіалкіл; алкоксигрупа; галогеналкоксигрупа; алкілтіогрупа; карбоцикліл (переважно циклогексил або цикlopентил), необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; і бензил, необов'язково заміщений алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою.

Більшість сполук загальної формули I є новими сполуками. Отже, згідно з другим аспектом, винахід представляє сполуки формули I, де

R^1 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним, або представляє гідроген;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, представляють будь-яку групу, визначену для R^1 , або разом з азотом, до якого приєднані, можуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним;

R^4 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним;

m дорівнює 1;

R^5 представляє будь-яку групу, визначену для R^4 і приєднану в положення 5 бензольного кільця М;

R^6 представляє необов'язково заміщений карбо- або гетероцикліл; і

А представляє безпосередній зв'язок; -O-; -S-; -NR⁹-, де R⁹ представляє алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких може бути заміщений алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або неонов'язково заміщеним фенілом; -CHR⁷- або -O-CHR⁷-, де R⁷ представляє алкіл, алкеніл або алкініл, які можуть бути заміщені алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою, алкілтіогрупою, галогеном або фенілом, неонов'язково заміщеним алкілом, галогеналкілом, алкоксигрупою, галогеналкоксигрупою або алкілтіогрупою; або представляє гідроксильну групу; галоген; ціаногрупу; ацил; алкоксигрупу; галогеналкоксигрупу; або алкілтіогрупу;

де -AR⁶ знаходиться в положенні 4 бензольного кільця М, і фрагмент, зображений з правої сторони зв'язку А приєднаний до R⁶;

або -AR⁶ і R⁵ разом з бензольним кільцем М утворюють неонов'язково заміщену конденсовану кільцеву систему.

Будь-яка алкільна група може бути лінійною або розгалуженою і, переважно, містить від 1 до 10 атомів карбону, найкраще, від 1 до 7, ще краще, від 1 до 5 атомів карбону.

Будь-яка алкенільна або алкінільна група може бути лінійною або розгалуженою, переважно, містить від 2 до 7 атомів карбону і може містити до 3 подвійних або потрійних зв'язків, які можуть бути сполученими, наприклад, бутадієніл або пропаргіл.

Будь-яка карбоциклільна група може бути насиченою, ненасиченою або ароматичною і містити від 3 до 8 атомів у кільці. Кращими насиченими карбоциклільними групами є циклопропіл, циклопентил або циклогексил. Кращі ненасичені карбоциклільні групи містять до 3 подвійних зв'язків. Кращою ароматичною карбоциклільною групою є феніл. Термін «карбоциклільний» варто розглядати аналогічно. Крім того, термін «карбоцикліль» включає будь-яке конденсоване сполучення карбоциклільних груп, наприклад, нафтил, фенантрин, інданіл або інданіл.

Будь-яка гетероциклільна група може бути насиченою, ненасиченою або ароматичною і містити від 5 до 7 атомів у кільці, з яких до 4 атомів можуть являти собою гетероатоми, такі як нітроген, оксиген і сульфур. Прикладами гетероциклільних груп є фурил, тієніл, піроліл, піролініл, піролідініл, імідазоліл, діоксоланіл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, імідазолініл, імідазолідиніл, піразоліл, піразолініл, піразолідиніл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, оксадіазоліл, триазоліл, тіадіазоліл, піраніл, піридиніл, піперидиніл, діоксаніл, морфоліногрупа, дитіаніл, тіоморфоліногрупа, піридазиніл, пірімідиніл, піразиніл, піперазиніл, сульфоланіл, тетразоліл, триазиніл, азепініл, оксазепініл, тіазепініл, діазепініл і тіазолініл. Крім того, термін «гетероцикліль» включає конденсовані гетероциклільні групи, наприклад, бензімідазоліл, бензоксазоліл, імідазопіридиніл, бензоксазиніл, бензотіазиніл, оксазоліпіридиніл, бензофураніл, хінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, дигідрохіназолініл, бензотіазоліл, фталімідогрупу, бензофураніл, бензодіазепініл, індоліл і ізоіндоліл. Термін «гетероциклільний» варто розглядати аналогічно.

Будь-яка алкільна, алкенільна, алкінільна, карбоциклільна або гетероциклільна група, коли є

заміщеною, може бути заміщена одним або декількома замісниками, які можуть бути однаковими або різними і можуть бути обраними з такого переліку: гідроксильна група; меркаптогрупа; азидогрупа; нітрогрупа; галоген; ціаногрупа; ацил; неонов'язково заміщена аміногрупа; неонов'язково заміщений карбоцикліль; неонов'язково заміщений гетероцикліль; ціанатогрупа; тіоціанатогрупа; -SF₅; -OR^a; -SR^a і -Si(R^a)₃, де R^a представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліль або гетероцикліль, кожний з яких може бути заміщеним. У випадку будь-якої карбоциклільної або гетероциклільної групи перелік додатково включає алкіл, алкеніл і алкініл, кожний з яких може бути заміщеним. Кращими замісниками на будь-якій алкілній, алкенільній і алкінілній групі є алкоксигрупа, галогеналкоксигрупа або алкілтіогрупа, кожна з яких містить від 1 до 5 атомів карбону; галоген; або неонов'язково заміщений феніл. Кращими замісниками на будь-якій карбоциклільній або гетероциклільній групі є алкіл, галогеналкіл, алкоксигрупа, галогеналкоксигрупа або алкілтіогрупа, кожний з яких містить від 1 до 5 атомів карбону; галоген; або неонов'язково заміщений феніл.

У випадку будь-якої алкільної групи або будь-якого ненасиченого карбоновмісного кільця в будь-якій карбоциклільній або гетероциклільній групі перелік включає таку двовалентну групу, як оксо- або іміногрупу, яка може бути заміщеною неонов'язково заміщеною аміногрупою, R^a або -OR^a (де R^a приймає значення, визначені вище). Кращими групами є оксо-, іміно-, алкіліміно-, оксимино-, алкілоксимино- або гідразоногрупа.

Будь-яка аміногрупа, коли є заміщеною там, де це потрібно, може бути заміщена одним або двома замісниками, які можуть бути однаковими або різними й обраними з такого переліку: неонов'язково заміщений алкіл, неонов'язково заміщена аміногрупа, -OR^a (де R^a приймає значення, визначені вище) і ацильна групи. Альтернативно, два замісники разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклільну групу, переважно, 5-7-членну гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною і може містити інші гетероатоми, наприклад, морфоліно-, тіоморфоліногрупа або піперидиніл.

Термін «ацил» включає залишки сульфуро- і фосфоровмісних кислот, а також карбонових кислот. Звичайно залишки позначаються загальними формулами -C(=X^a)R^b, -S(O)_pR^b і -P(=X^a)(OR^a)(OR^a), у яких відповідний X^a представляє O або S, R^b приймає значення, визначені для R^a, -OR^a, -SR^a, і представляє неонов'язково заміщену аміногрупу або ацил; і р дорівнює 1 або 2. Кращими групами є -C(=O)R^c і -C(=S)R^c і -S(O)_p, де R^c представляє алкіл, C₁-C₅алкоксигрупу, C₁-C₅алкілтіогрупу, феніл, гетероцикліль або аміногрупу, які можуть бути заміщеними.

Комплекси сполук згідно з винаходом звичайно одержують із солі формули MAn₂, у якій М представляє двовалентний катіон металу, наприклад, купруму, мангану, кобальту, нікелю, заліза або цинку, і An представляє аніон, наприклад, хлорид, нітрат або сульфат.

У випадках, коли сполуки згідно з винаходом існують у вигляді E і Z ізомерів, винахід включає окремі ізомери, а також їхні суміші.

У випадках, коли сполуки згідно з винаходом існують у вигляді таутомерних ізомерів, винахід включає окремі таутомери, а також їх суміші.

У випадках, коли сполуки згідно з винаходом існують у вигляді оптичних ізомерів, винахід включає окремі ізомери, а також їхні суміші.

Сполуки згідно з цим винаходом мають фунгіцидну активність, зокрема у відношенні хвороб рослин, які викликані грибами, наприклад, хвороб мільдю, зокрема справжньої борошнистої роси злаків (*Erysiphe graminis*) і несправжньої борошнистої роси винограду (*Plasmopara viticola*), пірикуляріозу рису (*Pyricularia oryzae*), вічкової плямистості злакових (*Pseudocercospora helminthosporiae*), *rice sheath blight* (*Pellicularia sasakii*), ціпії (*Botrytis cinerea*), випрівання (*Rhizoctonia solani*), бурі іржі пшениці (*Puccinia recondita*), фітофторозу томатів або картоплі (*Phytophthora infestans*), парші яблуні (*Venturia inaequalis*), плямистості колоскової луски (*glume blotch*) (*Leptosphaeria nodorum*). Інші грибки, проти яких можуть бути активними сполуки згідно з цим винаходом, включають інші види справжньої борошнистої роси, інші види іржі й інші загальні патогени, які беруть початок з *Deuteromycete*, *Ascomycete*, *Phycomycete* і *Basidiomycete*.

Винахід також представляє спосіб знищення грибків на заражених ділянках або ділянках, які можуть піддаватися зараженню, спосіб включає нанесення на зазначену ділянку сполуки формули I.

Винахід також представляє сільськогосподарську композицію, яка включає сполуки формули I у суміші з прийнятним для сільськогосподарського застосування наповнювачем або носієм.

Композиція згідно з цим винаходом, звичайно, може включати більш однієї сполуки згідно з цим винаходом.

Крім того, композиція може включати один або кілька додаткових активних інгредієнтів, наприклад, сполуки, які, як відомо, мають регулюючу ріст рослини активність, гербіцидні, фунгіцидні, інсектицидні, акарицидні, антимікробні або антибактеріальні властивості. Альтернативно, сполуку згідно з винаходом можна використовувати послідовно з іншим активним інгредієнтом.

Наповнювач або носій у композиції згідно з винаходом може бути твердим або рідким, необов'язково в сполученні з поверхнево-активною речовиною, наприклад дисперсантом, емульгатором або змочувальним агентом. Придатні поверхнево-активні речовини включають такі аніонні сполуки, як карбоксилат, наприклад, металкарбоксилат жирної кислоти з довгим ланцюгом; N-ацилсаркоцинат; моно- або діестери фосфатної кислоти і етоксилатів жирних спиртів або алкілфенолетоксилатів або солей таких естерів; сульфати жирних спиртів, такі як натрійдодецилсульфат, натрійоктадецилсульфат або натрійцетилсульфат; сульфати етоксированих жирних спиртів; сульфати етоксированих алкілфенолів; лігнінсульфонати; нафтові сульфони; алкіларилсульфонати, такі як алкілбензолсульфонати або нижчі алкілнафталін-

сульфонати, наприклад, бутилнафталінсульфонат; солі сульфонованих продуктів реакції конденсації нафталіну і формальдегіду; солі сульфонованих продуктів реакції конденсації фенолу і формальдегіду; або такі складніші сульфони, як амідсульфонати, наприклад, сульфований продукт конденсації олеїнової кислоти і N-метилтауріну; діалкілсульфосукцинати, наприклад, натрійсульфонат діоктилсукцинату; кислотні похідні алкілглікозидів і алкілполіглікозидних похідних і їх солі з металами, наприклад, похідні алкілполіглікозидцетрату або -тартрату; або моно-, ді- і триалкілові естери лимонної кислоти і їх солі з металами.

Неіоногенні поверхнево-активні речовини включають продукти конденсації естерів жирних кислот, жирних спиртів, амідів жирних кислот або жирних алкіл- або алкенілзаміщених фенолів з етиленоксидом і/або пропіленоксидом; жирні естери простих етерів багатоатомних спиртів, наприклад, сорбітанестери жирних кислот; продукти конденсації таких естерів з етиленоксидом, як наприклад, поліоксидетиленсорбітанестери жирних кислот; алкілглікозиди, алкілполіглікозидні похідні; блок-співполімери етиленоксиду і пропіленоксиду; такі ацетиленові гліколи, як 2,4,7,9-тетраметил-5-децин-4,7-діол, етоксировані ацетиленові гліколи; акрилові основні прищеплені співполімери; алкоксировані силосанові поверхнево-активні речовини або поверхнево-активні речовини імідазолінового типу, наприклад, 1-гідроксидетил-2-алкілімідазолін.

Приклади катіоногенних поверхнево-активних речовин включають, наприклад, аліфатичний моно-, ді- або поліамін у вигляді ацетату, нафтенату або олеату; кисне-вмісний амін, такий як аміноксид, поліоксидетиленалкіламін або поліоксипропіленалкіламін; амідоспрямлений амін, що отриманий конденсацією карбонової кислоти з ді- або поліаміном; або четвертинна амонієва сіль.

Композиції згідно з цим винаходом можуть мати будь-як відому для сільськогосподарських препаратів форму, наприклад, розчин, аерозоль, дисперсія, водна емульсія, мікроемульсія, дисперсійний концентрат, порошок для розпилення, препарат для обробки насіння, фумігант, дим, диспергований порошок, емульсійний концентрат, гранули або імпрегнована стрічка. Крім того, вона може мати форму, яка підходить для безпосереднього застосування, або являти собою концентрат або первинну композицію, які необхідно розбавляти відповідною кількістю води або іншого розріджувача перед застосуванням.

Дисперсійний концентрат включає сполуку згідно з винаходом, розчинену в одному або декількох змішуваних з водою або напівзмішуваних з водою розчинниках, з одним або декількома поверхнево-активною(ими) і/або полімерною(ими) речовиною(ами). Додавання препарату у воду приводить до кристалізації активного інгредієнта, причому цей процес, контрольований поверхнево-активними і/або полімерними речовинами, приводить до одержання тонкої дисперсії.

Порошок для розпилення (*dusting powder*) включає сполуку згідно з цим винаходом, ретельно змішану і подрібнену з твердим порошкоподібним наповнювачем, наприклад, з каоліном.

Емульсійний концентрат включає сполуку згідно з цим винаходом, розчинену в розчиннику, який змішують з водою, і який при додаванні до води в присутності емульгатора утворює емульсію або мікроемульсію.

Гранульований твердий препарат включає сполуку згідно з цим винаходом в суміші з наповнювачами, подібними до тих, з якими воно може застосовуватися в порошках для розпилення, але суміш гранульована відомими способами. Альтернативно, він включає активний інгредієнт, абсорбований або нанесений у вигляді покриття на попередньо отриманий гранульований носій, наприклад, фулерову землю (Fuller's earth), атапульгіт, діоксид силіцію або тверді частинки вапняку.

Порошки, які змочують, гранули або тверді частинки звичайно включають активний інгредієнт у суміші з придатними поверхнево-активними речовинами та таким інертним порошкоподібним наповнювач, як глина або діатомна земля.

Інший відповідний концентрат являє собою рідкий концентрат суспензії, який отримано подрібненням сполуки згідно з цим винаходом з водою або іншою рідиною, поверхнево-активними речовинами або суспендуєчим агентом.

Концентрація активного інгредієнта в композиції згідно з цим винаходом при застосуванні на рослини бажано знаходиться в інтервалі від 0,0001 до 1,0 процента за масою, переважно, від 0,0001 до 0,01 процента за масою. У первинній композиції кількість активного інгредієнта може змінюватися в широких межах і складати, наприклад, від 5 до 95 процентів маси композиції.

При застосуванні сполуку згідно з цим винаходом звичайно наносять на насіння, на рослини або на місця їх вирощування. Отже, сполуку можна наносити безпосередньо на ґрунт до або після посіву, щоб присутність активної сполуки в ґрунті могла знижувати ріст грибків, здатних впливати на насіння. Коли ґрунт обробляють безпосередньо, активна сполука може застосовуватися будь-яким способом, який дозволяє йому одночасно змішуватися з ґрунтом, таким як обприскування, розкид твердих гранул або внесення активного інгредієнта під час посіву в борозну разом з насінням. Відповідна доза знаходиться в інтервалі від 5 до 1000г на гектар, переважно, від 10 до 500г на гектар.

Альтернативно, активну сполуку можна наносити безпосередньо на рослину, наприклад, обприскуванням або розпиленням, або в той час, коли грибки починають з'являтися на рослині, або до появи грибків в якості захисної міри. В обох випадках кращим способом застосування є обприскування листя. Звичайно важливо одержати гарний результат знищення грибків на ранніх стадіях розвитку рослини, оскільки це час, коли рослина може піддаватися найбільш тяжкому пошкодженню. Розчин для обприскування або порошок звичайно може містити досходовий або післясходовий гербіцид, якщо це необхідно. На практиці іноді можна обробляти корені, цибулини, бульби або інші вегетативні частини рослини перед або під час посадки, наприклад, зануренням коренів у придатну рідку або тверду композицію. Коли активна сполука наноситься безпосередньо на рослину, відповідна

доза застосування складає від 0,025 до 5кг на гектар, переважно від 0,05 до 1кг на гектар.

Крім того, сполуки згідно з цим винаходом можна наносити на зібрані плоди, овочі або насіння для профілактики зараження під час збереження.

Сполуки згідно з цим винаходом також можна наносити на рослини або частини рослин, які були генетично модифіковані для проявлення таких особливостей, як фунгіцидна і/або гербіцидна резистентність.

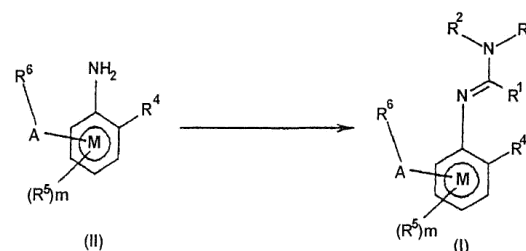
Сполуки згідно з цим винаходом також можна використовувати і для обробки грибкових заражень у деревині, і в суспільній охороні здоров'я. Сполуки згідно з цим винаходом також можна використовувати для обробки грибкових заражень у домашніх і сільськогосподарських тварин.

Сполуки згідно з цим винаходом можна отримати різними шляхами відомими способами.

Сполуки загальної формули I можна отримати зі сполук загальної формули II згідно зі схемою 1. Для здійснення перетворення можна використовувати наступні реакції:

- а) взаємодія з $R^2R^3NC(R^1)(OR)_2$, де R представляє таку групу, як алкіл;
- б) взаємодія з $ROC(R^1)=NCN$;
- в) коли R^1 представляє гідроген, взаємодію з $H(C=O)NR^2R^3$ у присутності $POCl_3$ або $SOCl_2$; або
- г) у дві стадії - взаємодією з фосгеном з утворенням ізоціанату і потім обробкою $R^2R^3N(C=O)R^1$.

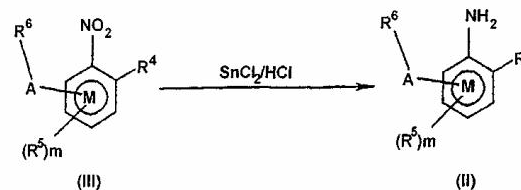
Схема 1



Крім того, групи R^2 і R^3 у сполуках загальної формули I можна перетворювати в інші групи, що визначені для R^2 і R^3 , обробкою придатним аміном, або ацилюванням чи алкілюванням, коли R^2 або R^3 представляє гідроген.

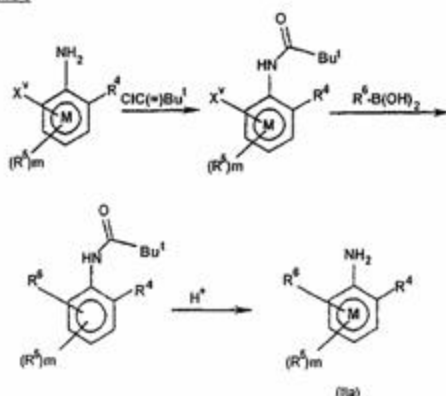
Сполуки загальної формули II можна отримати відновленням нітрогрупи в сполуках формули III, як показано на схемі 2. Бажані умови реакції включають взаємодію з хлоридом стануму в концентрованій гідрохлоридній кислоті.

Схема 2



Сполуки формули IIa, тобто сполука загальної формули II, у яких A представляє безпосередній зв'язок, можна отримати згідно зі схемою реакцій 3, де X^V представляє відщеплювану групу.

Схема 3



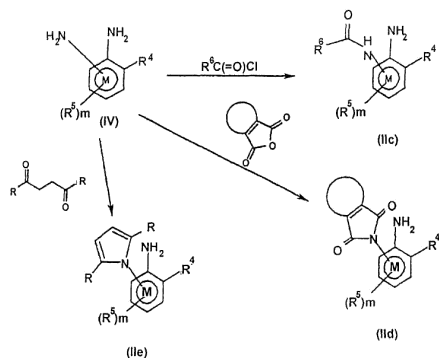
Сполуки формули IIb, тобто сполуки загальної формули II, у яких R^4 представляє галоген, можна отримати згідно зі способом, який представлений на схемі 4, де X^T представляє галоген. Коли R^4 є бромом, бажані умови реакції включають перемішування з бромом у відповідному розчиннику.

Схема 4



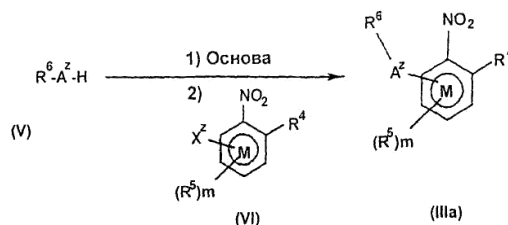
Сполуки формули IIc, тобто сполуки загальної формули II, у яких A представляє $NHC(=O)-$; сполуки формули IId, тобто сполуки формули II, у яких A представляє безпосередній зв'язок, R^6 представляє необов'язково заміщену фталімідогрупу, а крива лінія, що з'єднує положення 3 і 4 у фталімідогрупі, представляє необов'язково заміщене карбоциклічне кільце; і сполуки формули IIe, тобто сполуки загальної формули II, у яких A представляє безпосередній зв'язок, а R^6 представляє піроліл, що необов'язково заміщений у положеннях 2 і 5 однією або декількома групами R, які можуть бути однаковими або різними; можна отримати зі сполук формули IV згідно з методикою, представленою на схемі 5. При одержанні деяких сполук формули IV для поліпшення виходу може знадобитися протектування (вилучення протектувальної групи) аміногрупи, яка знаходиться в орто-положенні відносно R^4 .

Схема 5



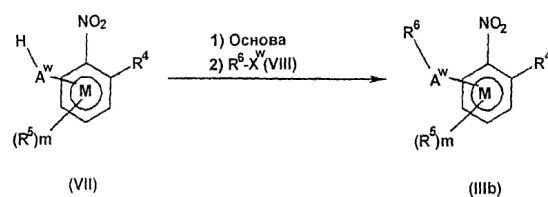
Сполуки формули IIIa, тобто сполуки загальної формули III, в яких A представляє групу A^Z , можна отримати взаємодією сполук формули V зі сполуками формули VI згідно зі схемою 6. A^Z представляє групу, яка у сполучі V в основних умовах утворює аніон. Альтернативно, A^Z представляє основний первинний або вторинний атом азоту. X^Z представляє відщеплювану групу, бажано галоген. Коли A^Z є киснем, кращі умови реакцій включають обробку V гідридом натрію з наступним додаванням VI. Коли A^Z є сульфуром, кращі умови реакції включають взаємодію V з VI у присутності такої третинної аміної основи, як етилдіізопропіламін. Коли A^Z представляє $-CHR^7$, кращі умови реакції включають обробку V трет-бутоксидом натрію в диметилформаміді при низькій температурі. Коли A^Z представляє основний атом азоту, основа непотрібна.

Схема 6



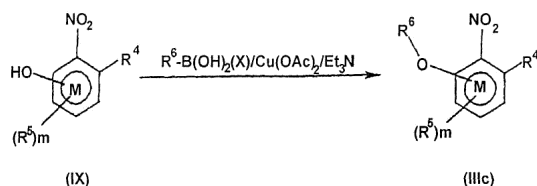
Сполуки формули IIIb, тобто сполуки загальної формули III, в яких A представляє групу A^W , можна отримати взаємодією сполук формули VII зі сполуками формули VIII, згідно зі схемою 7. A^W представляє групу, яка у сполучі VII в основних умовах утворює аніон. X^W є відщеплюваною групою, бажано галогеном. Кращі основні умови включають взаємодію VII з карбонатом калію чи гідридом натрію з наступним додаванням VIII.

Схема 7



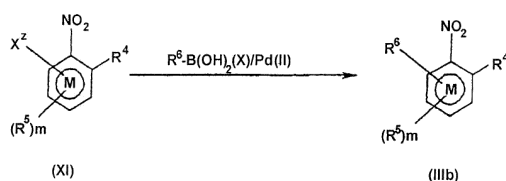
Сполуки формули IIIc, тобто сполуки загальної формули III, в яких A представляє O, можна отримати взаємодією сполук формули IX з бороновими кислотами формули X згідно зі схемою 8. Кращі умови реакції включають реакцію з ацетатом купруму і триметиламіном.

Схема 8



Сполуки формули IIIc, тобто сполуки формули III, в яких А представляє безпосередній зв'язок, можна отримати згідно зі схемою 9 із сполук формули XI, де X^Z представляє відщеплювану групу, бажано галоген.

Схема 9



Сполуки формули III, в яких А представляє безпосередній зв'язок, а R^6 представляє гетероцикл, можна отримати різними методами, відомими кваліфікованому хіміку (наприклад, див. "Comprehensive Heterocyclic Chemistry", Vols 1-7, A.R. Katritzky and C.W. Rees). Наприклад, способи одержання сполук формули III, які містять 1,2,4-оксадіазол-3-іл (сполука IIIe) і 1,3,4-оксадіазол-2-іл (сполука IIIf) показані на схемах 10 і 11.

Схема 10

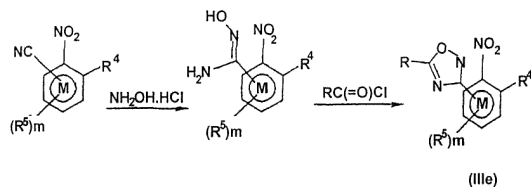
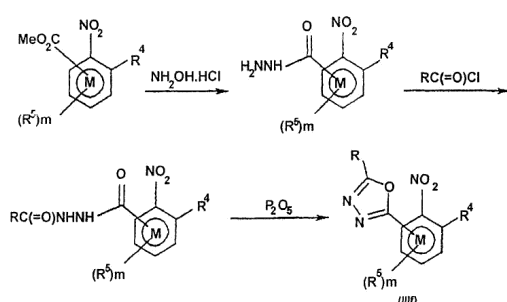


Схема 11



Альтернативно, за допомогою аналогічних описаних вище хімічних перетворень сполуки формули I можна отримати введенням R^6 після утворення амідного фрагменту.

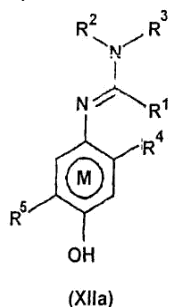
Зокрема, заявниками цього винаходу було виявлено, що обробка сполук формули XII згідно зі

схемою 7 приводить до одержання сполук формули Ia з особливо високим виходом, тобто сполук загальної формули I, в яких А представляє окисген (див. схему 12). Сполуки формули XII можна отримати способами, що аналогічні способам, які описані у публікації Tetrahedron Letters, 38(31)5403-5406.

Схема 12



Деякі сполуки загальної формули XII є новими сполуками, отже, згідно з третім аспектом, винахід представляє сполуки загальної формули XIIa,



де

R^1 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним, або представляє гідроген;

R^2 і R^3 , які можуть бути однаковими або різними, представляють будь-яку групу, визначену для R^1 ; ціаногрупу; ацил; $-OR^a$ або $-SR^a$, де R^a представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; або R^2 і R^3 , або R^2 і R^1 разом із з'єднуючими їх атомами можуть утворювати кільце, яке може бути заміщеним;

R^4 представляє алкіл, алкеніл, алкініл, карбоцикліл або гетероцикліл, кожний з яких може бути заміщеним; і

R^5 представляє будь-яку групу, визначену для R^4 , за умовою, що R^5 не є трет-бутилом.

Інші способи будуть зрозумілі кваліфікованому фахівцю в цій області, тому що це способи одержання вихідних сполук і проміжних продуктів.

Крім того, сполуки згідно з цим винаходом можна отримати з використанням методів комбінаторної хімії.

Винахід ілюстроване наведеними далі прикладами. Структури виділених нових сполук підтверджені даними ЯМР і/або іншими відповідними аналізами. Спектри протонного ЯМР (1H ЯМР) отримані в дейтерохлороформі, хімічні зсуви (δ) представлені в мільйонних частках униз від тетраметилсилану.

Приклад 1

N,N-Диметил-N'-[4-(3-трифлуорметилбензилтіо)-2,5-ксіліл]формамідин (Сполука 3)

Продукт зі стадії b) (1,0г) і N,N-диметилформаміддиметилацеталь (1,0мл) нагрівають до 100°C і витримують при цій температурі протягом 4 годин. Після охолодження суміш очищають хроматографією на силікагелі (елюювання: діетиловий етер), в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

¹H ЯМР (δ) 2,15 (с, 3H, ArCH₃), 2,20 (с, 3H, ArCH₃), 3,00 (с, 6H, N(CH₃)₂), 3,95 (с, 2H, SC₂H₅).

Одержання вихідних сполук

а) 2-Нітро-5-(3-трифлуорметилбензилтіо)-п-ксілол

Суміш 3-трифлуорметилбензилмеркаптану (3,42г), діізопропілетиламіну (2,3г) і 3-хлор-6-нітропара-ксілолу (3,0г) у сухому N-метилпіролідіноні (20мл) нагрівають до 130°C і витримують при цій температурі протягом 6 годин. Після охолодження суміш виливають у крижану воду й отриману суміш фільтрують з одержанням твердого осаду, який промивають крижаною водою і потім сушать на повітрі. Тверду речовину очищають хроматографією на силікагелі (елюювання: петролейний ефір (тем. кип. 60-80°C)/етилацетат (9:1)), у результаті одержують зазначений у заголовку продукт у вигляді твердої речовини, т. пл. 85-87°C.

б) 4-(3-трифлуорметилбензилтіо)-2,5-ксілідін

До суміші хлориду стануму (10,8г) у концентрованій гідрохлоридній кислоті (24мл) і етанолу (50мл) при перемішуванні додають продукт зі стадії а), описаної вище, суміш нагрівають до 75°C і витримують при цій температурі протягом 3 годин. Після охолодження повільно з охолодженням додають розчин гідроксиду калію. Суміш екстрагують діетиловим етером (х3), об'єднані екстракти промивають розсоллом, сушать (MgSO₄), фільтрують і випарюють досуха, залишок очищають хроматографією на силікагелі [елюювання: петролейний ефір (т. кип. 60-80°C)/етилацетат (3:1)], у результаті одержують зазначений у заголовку продукт, т. пл. 58-60°C.

Приклад 2

N,N-Діетил-N'-[4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксіліл]формамідин (Сполука 37)

Під атмосферою азоту оксихлорид фосфору (2,18г) у сухому діетиловому етері (3мл) додають краплями при перемішуванні в розчин N,N-діетилформаміду (1,43г) у сухому діетиловому етері (3мл), і перемішування продовжують протягом 20 хвилин. Перемішування припиняють і суміші дають відстоятися для поділу на два шари. Верхній етерний шар видаляють декантуванням, нижній шар промивають діетиловим етером (х3). Потім краплями додають продукт зі стадії b) (2г) у діетиловому етері (4мл). Після додавання суміш енергійно перемішують протягом 1 години при кімнатній температурі. Верхній етерний шар видаляють декантуванням, нижній шар промивають етером (х2). Нижній шар виливають у воду, рН суміші доводять до 9 за допомогою розчину карбонату натрію. Суміш екстрагують діетиловим етером (х3), об'єднані екстракти сушать (MgSO₄), фільтрують і випарюють досуха, одержують олію, яку очищають хроматографією на силікагелі (елю-

ювання: діетиловий етер), в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку, ¹H ЯМР (δ) 1,20 (т, 6H, CH₂CH₃), 2,10 (с, 3H, ArCH₃), 2,20 (с, 3H, ArCH₃), 3,30-3,50 (уш., 4H, CH₂CH₃).

Одержання вихідних сполук

а) 2-Нітро-5-(3-трифлуорметилфенокси)-п-ксілол

До суспензії гідриду натрію (0,4г 60% в маслі) у сухому N-метилпіролідіноні (10мл) повільно додають 3-трифлуорметилфенол (1,62г). Після припинення виділення бульбашок додають 3-хлор-6-нітро-п-ксілол (1,85г) і суміш перемішують при 120-140°C протягом 5 годин. Після охолодження суміш виливають у воду й отриману суміш екстрагують діетиловим етером (х3). Об'єднані органічні екстракти сушать (MgSO₄), фільтрують і випарюють, одержують зазначену в заголовку сполуку у вигляді твердої речовини, т. пл. 68-71°C.

б) 4-(3-Трифлуорметилфенокси)-2, 5-ксілідін

Ці сполуки одержують згідно зі способом одержання продукту стадії b) прикладу 1.

Приклад 3

N-Етил-N'-метил-N'-[4-(3-трифтометилфенокси)-2,5-ксіліл]формамідин (Сполука 45)

Суміш продукту з прикладу 4 (1г) і метилетиламіну (0,885г) в ацетонітрилі (20мл) перемішують при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. Розчинник видаляють у вакуумі і додають воду. Суміш екстрагують діетиловим етером (х3) і об'єднані етерні екстракти сушать (MgSO₄), фільтрують і випарюють досуха. Залишок очищають хроматографією на силікагелі [елюювання: етилацетат/петролейний ефір (т. кип. 40-60°C) (4:6)], і одержують зазначену в заголовку сполуку. ¹H ЯМР δ (м.д.) 1,20 (т, 3H, CH₂CH₃), 2,10 (с, 3H, ArCH₃), 2,20 (с, 3H, ArCH₃), 3,00 (с, 3H, NCH₃), 3,40 (уш., 2H, NCH₂).

Приклад 4

N-ціано-N'-[4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксіліл]формамідин (Сполука 44)

До розчину продукту зі стадії b) прикладу 2 (2г) в етанолі (5мл) краплями при кімнатній температурі додають етилціаноїмідат (0,7г) і перемішування продовжують при кімнатній температурі протягом 2 годин. Етанол видаляють у вакуумі, одержують сирий залишок, який очищають розтиранням з петролейним ефіром (т. кип. 40-60°C) і потім хроматографією на силікагелі [елюювання: етилацет/петролейний ефір (т. кип. 40-60°C)], в результаті одержують зазначений у заголовку продукт, т. пл. 138-140°C.

Приклад 5

N,N-Диметил-N'-[4-(3-феніл-1,2,4-тіадіазол-5-ілокси)-2,5-ксіліл]формамідин (сполука 48)

До суспензії вихідної сполуки (див. нижче) (0,57г) у диметилформаміді (10мл) додають карбонат калію (0,62г) і розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 40 хвилин. Додають 5-бром-3-феніл-1,2,4-тіадіазол (0,72г) і суміш перемішують при 60°C протягом 3 годин. Після охолодження суміш виливають у воду (150мл) і екстрагують діетиловим етером (3x70мл). Об'єднані етерні екстракти ромивають водою (20мл), сушать (MgSO₄), фільтрують і випарюють досуха, одержують сирий твердий продукт, який очищають

хроматографією на силікагелі (елюювання: діетиловий етер), у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку у вигляді твердої речовини, т. пл. 100-105°C.

Одержання вихідних сполук

N,N-Диметил-N'-(4-гідрокси-2,5-ксиліл)формамідин

Ці сполуки одержують з 4-аміно-2,5-диметилфенолу згідно з методикою, описаною в прикладах 1, 2 або 3, т. пл. 212°C.

Приклад 6

N,N-Диметил-N'-(4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,6-ксиліл)формамідин (Сполука 20)

Цю сполуку одержують із продукту стадії b), що описано нижче, і диметилформаміддиметилацеталу згідно з методикою, описаною в прикладі 1, ^1H ЯМР δ (м.д.) 2,15 (с, 6H, ArCH_3), 3,00 (с, 6H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$).

Одержання вихідних сполук

а) 2-Нітро-5-(3-трифлуорметилфенокси)-м-кислосол

Суміш 3,5-диметил-4-нітрофенолу (1,67г), 3-трифтометил-бензолборонової кислоти (3,8г), ацетату купруму (III) (1,82г) і триетиламіну (2,02г) у дихлорметані (50мл) перемішують при кімнатній температурі протягом 48 годин. Суміш випарюють досуха і залишок очищають хроматографією на силікагелі [елюювання: петролейний ефір (т. кип. 60-80°C) /етилацетат (19:1)], в результаті одержують зазначений у заголовку продукт у вигляді олії.

б) 4-(3-Трифтометилфенокси)-2,6-ксилідин

Цю сполуку одержують із продукту стадії а), описаної вище, згідно з методикою стадії b) прикладу 1.

Приклад 7

N,N-Диметил-N'-(6-бром-4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксиліл)формамідин (Сполука 12)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту описаної нижче стадії c) і диметилформаміддиметилацеталу згідно зі способом, описаним в прикладі 1, ^1H ЯМР δ (м.д.) 2,17 (с, 3H, ArCH_3), 2,22 (с, 3H, ArCH_3), 3,05 (с, 6H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$).

Одержання вихідних сполук

а) 2-Нітро-5-(3-трифлуорметилфенокси)-п-кислосол

Зазначену в заголовку сполуку одержують з 2,5-диметил-4-нітрофенона і 3-трифлуорметилбензолборонової кислоти згідно з методикою, описаною на прикладі 6 стадії а).

б) 4-(3-Трифлуорметилфенокси)-2,5-ксилідин

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії а) згідно з методикою прикладу 1 стадії b).

с) 6-Бром-4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксилідин

До розчину продукту з описаної вище стадії b) (1,12г) у дихлорметані (20мл) при перемішуванні додають краплями бром (0,64г) у дихлорметані (5мл) при 0°C. Суміш промивають розчином гідрокарбонату натрію, сушать (MgSO_4), фільтрують і випарюють, одержують сиру олію, яку очищають хроматографією на силікагелі [елюювання: етилацетат/петролейний ефір (т. кип. 60-80°C) (1:4)], в

результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

Приклад 8

N,N-Диметил-N'-(4-(3-трифлуорметилфеніл)-2,5-ксиліл)формамідин (Сполука 53)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту описаної нижче стадії c) і диметилформаміддиметилацеталу згідно з описаною в прикладі 1 методикою, ^1H ЯМР δ (м.д.) 2,00 (с, 3H, ArCH_3), 2,20 (с, 3H, ArCH_3), 3,00 (с, 6H, $(\text{NCH}_3)_2$).

Одержання вихідних сполук

а) N-(4-бром-2,5-ксиліл)піваламід

До розчину 4-бром-2,5-ксилідину (8г) у піридині (60мл) при кімнатній температурі додають півалоїлхлорид (4,78мл). Через 30 хвилин суміш виливають у суміш розведеної гідрохлоридної кислоти/льодяний розчин. Осад відфільтровують і промивають водою, в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

б) N-(4-(3-Трифлуорметилфеніл)-2,5-ксиліл)піваламід

До розчину продукту зі стадії а) (9,1г) у диметоксетані (14мл) додають хлорид трифенілфосфінапалладію (II) (каталітична кількість) і отриману суміш перемішують протягом 10 хвилин. Додають 3-трифлуорметилфенілборонову кислоту (6,03г), гідрокарбонат натрію (8,1г) і воду (102мл) і суміш кип'ятять зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Після охолодження додають 1Н розчин гідроксиду натрію (94мл) і суміш екстрагують етилацетатом. Органічні екстракти промивають насиченим розчином хлориду натрію, сушать (MgSO_4) і концентрують, в результаті одержують зазначений у заголовку продукт.

с) 4-(3-Трифлуорметилфеніл)-2,5-ксилідин

Продукт зі стадії b) (10,4г) у льодяній оцтовій кислоті (36мл) обробляють гідрохлоридною кислотою (24,5мл 15% розчину) при 70°C. Суміш перемішують протягом 3 діб при 100°C. Після охолодження додають воду й отриману суміш екстрагують етилацетатом. Органічну фазу промивають розчином гідрокарбонату натрію, сушать (MgSO_4) і концентрують, у результаті одержують зазначений у заголовку продукт.

Приклад 9

N,N-Диметил-N'-(4-(3-трифлуорметилбензил)-2,5-ксиліл)формамідин (Сполука 264)

Зазначену в заголовку сполуку одержують з продукту стадії d), описаної нижче, згідно з методикою, описаною в прикладі 1, т. пл. 75-77°C.

Одержання вихідних речовин

а) 2-Нітро-5-(α -ціано-3-трифлуорметилбензил)-п-кислосол

Зазначену в заголовку сполуку одержують з 2-хлор-5-нітро-п-кисилола і 3-трифлуорметилбензилціаніду згідно з методикою, описаною в публікації J. Med. Chem., 40, 3942 (1997).

б) 2-Нітро-5-(3-трифлуорметилбензоїл)-п-кислосол

Трет-бутоксид калію (1,12г) додають до розчину продукту стадії а) (3,3г) у сухому диметилформаміді (30мл) при 0°C і перемішують при 0°C протягом 5 хвилин. Краплями додають пероксид водню (3,5мл, 30%) і перемішування продовжують протягом 6 годин при температурі приблизно

3°C. Реакційну суміш залишають при кімнатній температурі на 2 дні. Реакційну суміш виливають у розведenu гідрохлоридну кислоту (500мл) і додають метабісульфіт натрію. Суміш екстрагують діетиловим етером (2x20мл), промивають водою (2x20мл), сушать (MgSO₄) і концентрують з одержанням сирого продукту. Розтирання з петролейним ефіром (т. кип. 40-60°C) приводить до одержання твердої речовини, яку перекристалізують з діізопропілового етеру, у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

с) 2-нітро-5-(3-трифлуорметилбензил)-п-кислол

До розчину продукту зі стадії b) (1г) у дихлорметані (20мл) при 0°C додають розчин трифлуорметансульфонової кислоти (0,6мл) у дихлорметані (10мл). Додають триетилсилан (0,8мл) у дихлорметані (10мл) і суміш перемішують при 0°C протягом 10 хвилин. Додають додаткову порцію трифлуорметансульфонової кислоти (0,6мл) і додаткову порцію триетилсилану (0,8мл). Суміші дають нагрітися до кімнатної температури і перемішують протягом 1 години. Суміш виливають у насичений розчин гідрокарбонату натрію (100мл) і тверду неорганічну речовину відфільтровують. Шари відокремлюють і водний шар екстрагують дихлорметаном (2x50мл). Об'єднані органічні шари випарюють і залишок перекристалізують, в результаті одержують тверду речовину, т. пл. 75-77°C.

д) 4-(3-Трифлуорметилбензил)-2,5-ксілідін
Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії с) згідно з методикою прикладу 1 стадії b).

Приклад 10

N,N-Диметил-N'-[4-(4-флуорбензамідо)-2,5-ксіліл]формамідін (Сполука 98)

Зазначену в заголовку сполуку одержують з вихідної речовини згідно з методикою прикладу 1, т. пл. 166-168°C. Одержання вихідних сполук N-(4-Аміно-2,5-ксіліл)-4-флуорбензамід

До розчину п-ксілілендіаміну (3,0г) і етилдіізопропіламіну (3,8мл) у дихлорметані (300мл) при 0°C краплями додають 4-флуорбензоїлхлорид (3,5г). Суміш нагрівають до кімнатної температури і перемішування продовжують протягом 4 годин. Додають воду (200мл) і суміш перемішують протягом 30 хвилин. Суміш фільтрують, промивають водою і дихлорметаном. Органічну фазу промивають водою, сушать (MgSO₄) і випарюють, у результаті одержують тверду речовину, т. пл. 174-176°C.

Приклад 11

N,N-Диметил-N'-(4-фталімідо)-2,5-ксіліл]формамідін (Сполука 80)

Зазначену в заголовку сполуку одержують з вихідної сполуки згідно з методикою, описаної в прикладі 1, т. пл. 170-173°C.

Одержання вихідних сполук

N-(4-Аміно-2,5-ксіліл)фталімід

До розчину п-ксілілендіаміну (1,0г) у N-метилпіролідініоні додають фталевий ангідрид (1,1г) у N-метилпіролідініоні (10мл). Суміш нагрівають до 150°C і витримують при цій температурі протягом 4 годин. Після охолодження суміш вили-

вають у воду і потім фільтрують. Осад на фільтрі промивають водою і сушать, т. пл. 167-169°C.

Приклад 12

N,N-Диметил-N'-[4-(2,5-диметил-1-піроліл)-2,5-ксіліл]формамідін (Сполука 79)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії с), описаної нижче, згідно з методикою, описаної в прикладі 1, т. пл. 90-91°C.

Одержання вихідних сполук

а) N-(4-аміно-2,5-ксіліл)ацетамід

До розчину п-ксілілдіаміну (2,0г) у дихлорметані (200мл) при температурі нижче 10°C додають N,N-діізопропіламін (2,52мл), потім краплями додають ацетилхлорид (1,15г). Суміші дають нагрітися до кімнатної температури і перемішують протягом ночі. Додають воду і суспензію фільтрують. Відфільтровану тверду речовину промивають дихлорметаном (2x100мл) і водою (100мл). Усі фільтрати поєднують і органічний шар відокремлюють. Органічний шар промивають водою, сушать (MgSO₄) і випарюють, в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку у вигляді твердої речовини, т. пл. 133-135°C.

б) N-[4-(2,5-диметил-1-піроліл)-2,5-ксіліл]ацетамід

Продукт зі стадії а) (1,0г) додають до ацетонілацетону (0,7мл), суміш нагрівають до 140°C і витримують при цій температурі протягом 4 годин. Після охолодження суміш розчиняють у дихлорметані і розчин фільтрують через MgSO₄. Після випарювання одержують сирий продукт, який очищають хроматографією на силікагелі (елювання: діетиловий етер), у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

с) 2,5-Диметил-4-(2,5-диметил-1-піроліл)анілін

Суміш продукту зі стадії б) (0,6г), водного розчину гідроксиду натрію (10мл, 10%) і етанолу (30мл) кип'ятять зі зворотним холодильником протягом 24 годин. Після охолодження суміш екстрагують діетиловим етером (x2). Об'єднані етерні екстракти промивають водою, сушать (MgSO₄) і концентрують, в результаті одержують сирий продукт. Фільтрування через силікагель приводить до одержання зазначеної в заголовку сполуки.

Приклад 13

N,N-Диметил-N'-[4-(2-бензо[b]тіофеніл)-2,5-ксіліл]формамідін (Сполука 187)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту зі стадії б), описаної нижче, за методикою прикладу 1, т. пл. 67-68°C.

Одержання вихідних сполук

а) 2-(4-Нітро-2,5-ксіліл)бензо[b]тіофен

Суміш 2-бром-5-нітро-п-ксілола (200г), 2-бензо[b]тіофенборонової кислоти (200г), (PH₃P)₄Pd (0,36г) у толуолі (60мл) і етанолу (22мл) кип'ятять зі зворотним холодильником протягом ночі. Додають етилацетат і воду й органічну фазу відокремлюють. Органічну фазу промивають водою, сушать (MgSO₄) і фільтрують через пухий шар діоксиду силіцію, в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку.

б) 2,5-Диметил-4-(2-бензо[b]тіофеніл)анілін

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії а), описаної вище, згідно з методикою прикладу 1 стадії б).

Приклад 14

N,N-Диметил-N'-[4-[5-(4-хлорфеніл)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]-2-толіл]формамідин (Сполука 179)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії с), описаної нижче, згідно з методикою, описаною в прикладі 1, т. пл. 136-137°C.

Одержання вихідних сполук

а) 3-Метил-4-нітробензамідоксим

До розчину 3-метил-4-нітробензонітрилу (5г) у етанолі (100мл) при кімнатній температурі додають гідрохлорид гідроксиламіну (2,25г) і потім триетиламін (4,5мл). Суміш кип'яють зі зворотним холодильником протягом 2,5 годин. Після охолодження суміш упарюють до однієї третини первісного об'єму і виливають у воду (200мл). Суміш фільтрують, в результаті одержують зазначену в заголовку сполуку у вигляді твердої речовини, т. пл. 127-129°C.

б) 5-(4-Хлорфеніл)-3-(3-метил-4-нітрофеніл)-1,2,4-оксадіазол

До розчину продукту зі стадії а) (1,9г) і триетиламіну (1,62мл) у дихлорметані (50мл) при кімнатній температурі додають 4-хлорбензоїлхлорид (2,05г). Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 2 годин і промивають водою. Додають толуол (100мл) і суміш нагрівають і витримують в умовах Дина-Старка протягом 5 годин. Після охолодження суміш фільтрують і концентрують. Розтирання з діізопропіламіном і петролейним ефіром (т. кип. 40-60°C) приводить до одержання зазначеного в заголовку продукту, т. пл. 145-147°C.

с) 4-[5-(4-(Хлорфеніл)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)-2-метиланілін

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту зі стадії б) згідно з методикою прикладу 1 стадії б).

Приклад 15

N,N-Диметил-N'-[4-(5-трет-бутил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-2-метилфенілі]формамідин (Сполука 211)

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії с), описаної нижче, згідно зі способом прикладу 1, т. пл. 79-80°C.

Одержання вихідних сполук

а) N-(3-Метил-4-нітробензоїл)-N'-півалоїлгідрозин

До розчину 3-метил-4-нітробензоїлгідрозину (3,9г) у дихлорметані (100мл) додають триетиламін (3,06мл) з наступним додаванням півалоїлхлориду (2,6мл). Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 2 годин. Суміш промивають водою, сушать (MgSO₄) і концентрують. Розтирання з петролейним ефіром (т. кип. 60-80°C) приводить до одержання зазначеної в заголовку сполуки, т. пл. 125-127°C.

б) 5-трет-бутил-2-(3-метил-4-нітрофеніл)-1,3,4-оксадіазол

Продукт, що отриманий на стадії а) (5,0г), перемішують у толуолі (200мл) і обробляють пентоксидом фосфору (10г). Суміш кип'яють зі зворотним холодильником протягом 2 годин і потім виливають у крижану воду. Суміш екстрагують діетиловим етером, екстракт сушать (MgSO₄) і концентрують. Залишок очищають хроматографією на силікагелі [елювання: діетиловий етер/петролейний ефір (т. кип. 60-80°C)], у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку, т. пл. 123-125°C.

с) 2-(4-Аміно-3-метил)-5-трет-бутил-1,3,4-оксадіазол

Зазначену в заголовку сполуку одержують із продукту стадії б) згідно з методикою стадії б) прикладу 1.

Приклад 16

N-Ціано-N-метил-N'-[4-(4-хлор-3-трифлуорметилфенокси)-2-ксиліл]формамідин (Сполука 373)

Продукт зі стадії с) (0,4г) у тетрагідрофурані (10мл) обробляють гідридом натрію (0,05г), додають йодметан (0,075мл) і суміш перемішують. Суміш гасять водою й екстрагують дихлорметаном. Екстракти сушать (MgSO₄) і випарюють. Отриманий залишок очищають хроматографією на силікагелі, у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку. ¹H ЯМР δ (м.д.) 2,10 (с, 3H, ArCH₃), 2,20 (с, 3H, ArCH₃), 3,35 (с, 3H, NCH₃).

Приклад 17

N-Ціано-N'-[4-(4-хлор-3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксиліл]формамідин (Сполука 397)

Зазначену в заголовку сполуку одержують згідно з методикою прикладу 4 із продукту стадії б), описаної вище, т. пл. 111-114°C.

Одержання вихідних сполук

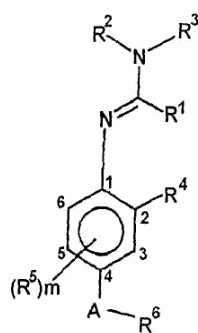
а) 2-Нітро-5-(4-хлор-3-трифлуорметилфенокси)-п-ксилол

Зазначену в заголовку сполуку одержують згідно з методикою стадії а) прикладу 2.

б) 4-(2-Хлор-3-трифлуорметилфенокси)-2, 5-ксилідин

Зазначену в заголовку сполуку одержують згідно з методикою стадії б) прикладу 1 із продукту стадії а), описаної вище.

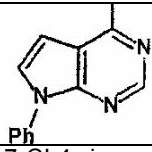
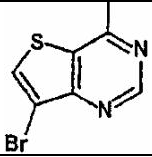
Приведені далі сполуки формули Ia (див. таблицю 1), тобто сполуки загальної формули I, в яких -A-R⁶ знаходиться в пара-положенні відносно амідинового фрагменту, можна отримати методами, аналогічними приведеним в прикладах 1-17, де фрагмент, розташований із правої сторони зв'язку А, приєднаний до R⁶.

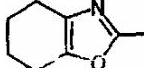


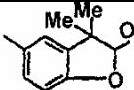
(Ia)

Таблиця 1

Спол.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	(R ⁵) _m	A	R ⁶	Т. пл./°C
1	2	3	4	5	6	7	8	9
1	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	49-50
2	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
3	H	Me	Me	Me	5-Me	-SCH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	олія
4	H	Me	Me	Me	5-Me	S	3-CF ₃ -феніл	олія
5	Me	Me	Me	Me	5-Me	-SCH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	олія
6	Me	Me	Me	Me	5-Me	S	3-CF ₃ -феніл	олія
7	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Cl-феніл	олія
8	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	69-71
9	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-толіл	олія
10	Me	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	олія
11	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	50-54
12	H	Me	Me	Me	5-Me, 6-Br	O	3-CF ₃ -феніл	олія
13	H	Me	Me	Me	-	O	3-CF ₃ -феніл	олія
14	H	Me	Me	CF ₃	-	O	3-CF ₃ -феніл	олія
15	H	Me	Me	Br	5-OMe	O	3-CF ₃ -феніл	68-70
16	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH(Me)-	3-CF ₃ -феніл	97-99
17	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	3-PhO-феніл	олія
18	H	Me	Me	Br	3-Me, 6-Br	O	3-CF ₃ -феніл	олія
19	H	Me	Me	Br	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
20	H	Me	Me	Me	6-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
21	H	Me	Me	Me	5-Pr ⁱ	O	3-CF ₃ -феніл	олія
22	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-біфеніліл	олія
23	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-F-феніл	олія
24	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-CF ₃ -феніл	олія
25	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-CF ₃ -феніл	олія
26	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,4-диMeO-феніл	олія
27	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-MeO-феніл	олія
28	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-PhO-феніл	олія
29	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CN-феніл	олія
30	H	Me	Me	Me	5-Me	O	бензоксазол-2-іл	107-109
31	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2,6-ксиліл	олія
32	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,4-диCl-феніл	олія
33	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-EtOC(=O)-феніл	олія
34	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-толіл	олія
35	H	-(CH ₂ O(CH ₂) ₂ -	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
36	H	H	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	122-123
37	H	B	Et	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
38	H	Pr	Pr	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
39	H	Bu	Bu	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
40	H	Pr ⁱ	Pr ⁱ	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
41	H	-(CH ₂) ₄ -	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	71-73

1	2	3	4	5	6	7	8	9
42	H	Ph	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
43	H	-(CH ₂) ₅ -	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
44	H	H	CN	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	138-140
45	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
46	H	Pr	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	44-46
47	H	бензил	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	121-123
48	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	100-105
49	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH(Me)-	3-CF ₃ -феніл	97-99
50	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-CF ₃ -феніл	олія
51	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-CF ₃ -феніл	олія
52	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Cl-5-CF ₃ -2-піридил	олія
53	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	3-CF ₃ -феніл	олія
54	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4,6-диMe-піримідин-2-іл	95-99
55	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,5-диCl-феніл	67-69
56	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-MeO-феніл	олія
57	H	циHex	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	93-4
58	H	Pri	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	62,5-64,5
59	H	Et	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	100-102
60	H	Me	Me	Me	5-Me	-NH-(C=O)-	3,5-диMe-4-оксазоліл	215-218
61	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Bu ^t -феніл	95-6
62	H	HO	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	130-1
63	H	MeO	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	59-61
64	H	EtO	H	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	68-9
65	H	Me	Me	Me	5-Me	O	феніл	олія
66	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Cl-1,2,4-тіадіазол-5-іл	120-122
67	H	Me	Me	Pr ^t	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
68	H	Me	Me	Me	5-Cl	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	99-101
69	H	Me	Me	Me	5-Me	SO ₂	3-CF ₃ -феніл	122-123
70	H	Me	Me	Me	5-Me	-N(Me)-C(=O)-	3,5-диMe-ізоксазол-4-іл	олія
71	H	Me	Me	Me	3-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
72	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Br-1,2,4-тіадіазол-5-іл	129-131
73	H	Me	Me	Me	5-Me	-NHC(=O)-	феніл	180-181
74	H	Me	Me	Me	5-Me	-N(Me)C(=O)-	феніл	олія
75	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	піперидиніл	93-94
76	H	Me	Me	Me	5-Me	O		124-126
77	H	Me	Me	Me	5-Me	O	7-Cl-4-хіназолініл	160-162
78	H	Me	Me	Me	5-Me	O		170-172
79	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	2,5-диMe-1-піроліл	90-91
80	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	фталімідо	170-173
81	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-CF ₃ -1,3,4-тіадіазол-2-іл	олія
82	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Bu ^t -1,3,4-тіадіазол-2-іл	104-106
83	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Ph-1,3,4-тіадіазол-2-іл	олія
84	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Cl-бензтіазол-2-іл	109-111
85	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-NO ₂ -2-тіазоліл	олія
86	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Ph-2-тіазоліл	111-114
87	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	морфоліно	93-94

1	2	3	4	5	6	7	8	9
88	H	Me	Me	Me	5-Me	O	8-F-4-хіназолініл	98-100
89	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,6-диNO ₂ -4-кумариніл	178-181
90	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-F-феніл	олія
91	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4,6-диMeO-1,3,5-тріазин-2-іл	82-84
92	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	3-Et ₂ NC(=O)-1-піперидиніл	олія
93	H	Me	Me	Me	5-Me	S		олія
94	H	Me	Me	Me	5-Me	S	4-(4-Cl-феніл)-2-оксазоліл	олія
95	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-Cl-феніл)-2-оксазоліл	олія
96	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-CF ₃ -4-хіназолініл	119-121
97	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	4,5-диCl-фталімідо	196-198
98	H	Me	Me	Me	5-Me	-NHC(=O)-	4-F-феніл	166-168
99	H	CN	H	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
100	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
101	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-CF ₃ -піримідин-2-іл	123-125
102	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	2,6-диMe-морфолін-4-іл	102-103
103	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-CF ₃ -4-хінолініл	126-128
104	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-толіл	олія
105	R	Me	Me	Me	5-Me	O	2-Pr ⁱ -феніл	олія
106	H	Et	H	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	74-76
107	Et	Me	Me	H	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	89-91
108	Me	Me	Me	H	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
109	H	Me	Me	H	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
110	Et	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	113-116
111	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	4-Me-1-піперазиніл	67-68
112	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(2-тіазоліл)-2-тіазоліл	110-112
113	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Bu ^t -2-тіазоліл	олія
114	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4-Cl-феніл)-1,2,4-оксадіазол-5-іл	106-108
115	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	2-Me-5-(3-CF ₃ -феніл)-1-пірроліл	олія
116	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-MeO-1,2,4-тіадіазол-5-іл	99-101
117	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Me-1,2,4-тіадіазол-5-іл	92-94
118	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Ph-3-піридазиніл	86-9
119	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Me-3-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
120	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(3-CF ₃ -феніл)-2-тіазоліл	93-95
121	H	Me	Me	Me	5-Me	S	4-Me-1,2,4-тріазол-3-іл	олія
122	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CN-2-піразиніл	128-130
123	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
124	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-втор-Бутилфеніл	олія
125	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-біфеніліл	олія
126	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-ізопропеніл-1,3,4-тіадіазол-2-іл	олія
127	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Ph-1,3,4-оксадіазол-2-іл	120-122
128	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	1,2,3,4-тетрагідро-2-ізохінолініл	олія
129	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-NEt ₂ -феніл	олія
130	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-вторбутилфеніл	олія
131	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Cl-6-Et-піримідин-4-іл	100-101
132	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-CF ₃ -піримідин-4-іл	62-63
133	H	Me	Me	Me	5-Me	O	1-Me-5-Cl-6-оксопіридазин-4-іл	142-145
134	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-5-ізоксазоліл	олія
135	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Br-феніл	олія
136	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(диметил-амінометиленаміно)феніл	олія
137	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-1,2,5-тіадіазол-3-іл	олія

1	2	3	4	5	6	7	8	9
138	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
139	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-Cl-феніл	олія
140	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-MeS-5-EtOC(=O)-піримідин-4-іл	олія
141	H	Me	Me	Me	5-Me	O	1-нафтил	олія
142	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-нафтил	олія
143	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	1-нафтил	олія
144	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	2-нафтил	110-112
145	H	Me	Me	Me	5-Me	O	1-Ph-тетразол-5-іл	123-126
146	H	Me	Me	Me	5-Me	O	1,1-діоксобензотіазол-3-іл	177-178
147	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	2-бензо[b]-фураніл	90-91
148	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Ph-піримідин-4-іл	олія
149	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Pr'-феніл	олія
150	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-ацетил-феніл	олія
151	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(1,1,3,3-тетраметил-бутил)феніл	олія
152	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Pr'-феніл	олія
153	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	3,4-diCl-феніл	олія
154	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	4-гексилфеніл	олія
155	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2,6-ксиліл	олія
156	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)CH ₂ -	4-Ci-феніл	олія
157	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)CH ₂ -	Феніл	олія
158	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)CH ₂ -	3-MeO-феніл	олія
159	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2,6-diCl-феніл	олія
160	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	3-Cl-2-бензо[b]-тіофеніл	олія
161	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	Циклогексил	олія
162	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2,4-diCl-феніл	олія
163	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2-CF ₃ -феніл	олія
164	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2,3-diCl-феніл	олія
165	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	3,5-diMe-ізоксазол-4-іл	олія
166	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	4-Me-1,2,3-тіадіазол-5-іл	олія
167	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2-F-3-CF ₃ -феніл	олія
168	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	3-Cl-2-MeO-5-піридил	олія
169	H	Me	Me	Me	5-Me	-OC(=O)-	2-Cl-3-піридил	олія
170	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(трет-пентил)феніл	олія
171	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Et-феніл	олія
172	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(трет-пентил)феніл	олія
173	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-Me-феніл	олія
174	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,4-ксиліл	олія
175	H	Me	Me	Me	5-Me	O		94-96
176	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	2-тісніл	олія
177	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	5-Cl-2-тісніл	олія
178	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	3-Cl-2-бензо[b]фураніл	114-115
179	H	Me	Me	Me	H	безпосередній зв'язок	5-(4-Cl-феніл)-1,2,4-оксадіазол-3-іл	136-137
180	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-ноніл-феніл	олія
181	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Et-феніл	олія
182	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-біфеніліл	олія
183	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-феніл	олія
184	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-MeS-феніл	олія
185	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Br-феніл	олія
186	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	2-(4-Cl-феніл)-4-тіазоліл	86-89
187	H	Me	Me	Me	5-Me	безпосередній зв'язок	2-бензо[b]тіофеніл	67-68
188	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-(5,6,7,8-тетрагідро)нафтил	84-86

1	2	3	4	5	6	7	8	9
189	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(α,α -диMe-бензил)феніл	олія
190	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ O-феніл	олія
191	Me	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	3-Et ₂ NC(=O)-1-піперидиніл	олія
192	H	Me	Me	Me	5-Me	S	Феніл	72-73
193	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-MeO-феніл	57-58
194	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-CF ₃ -2-бензтіазоліл	106-107
195	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-2-бензтіазоліл	109-111
196	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Cl-2-бензтіазоліл	олія
197	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-бензтіазоліл	олія
198	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-Pr ¹ -5-Me-феніл	олія
199	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	2-Pr ¹ -5-Me-феніл	олія
200	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-Et-феніл	олія
201	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-Et-феніл	олія
202	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Me-4-MeS-феніл	олія
203	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-бензоїл-феніл	олія
204	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-пропіонілфеніл	олія
205	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(3-Me-1,2,4-тіадіазол-5-іл)феніл	109,5-111
206	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	113-114
207	H	Me	Me	Me	H	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
208	H	Me	Me	Me	5-Pr ¹	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
209	Me	Me	Me	Me	H	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
210	H	Me	Me	Me	H	Безпосередній зв'язок	5-Bu ¹ -1,2,4-оксадіазол-3-іл	олія
211	H	Me	Me	Me	H	Безпосередній зв'язок	5-Bu ¹ -1,3,4-оксадіазол-2-іл	79-80
212	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-ацетилфеніл	80-81
213	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3-CF ₃ -феноксі)феніл	олія
214	H	Me	Me	Me	5-Me	-CH(CN)-	3-CF ₃ -феніл	олія
215	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-Cl-феніл)-2-тіазоліл	олія
216	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-толіл)-2-тіазоліл	олія
217	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-MeO-феніл)-2-тіазоліл	олія
218	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Cl-піримідин-4-іл	205-207
219	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-оксо-2-Ph-4H-1-бензопіран-6-іл	олія
220	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-(бензилокси)феніл	олія
221	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,4-метилendioксифеніл	олія
222	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,5-ксиліл	олія
223	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,5-диMeO-феніл	олія
224	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-PhO-піримідин-4-іл	олія
225	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
226	H	Me	Me	Me	5-Me	Безпосередній зв'язок	3-Cl-2-бензо[b]тіо-феніл	84-86
227	H	CN	H	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
228	H	Me	Me	Me	H	Безпосередній зв'язок	5-(4-Cl-феніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл	168-169
229	Me	Me	Me	Me	H	Безпосередній зв'язок	5-(4-Cl-феніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл	133-5
230	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Pr ¹ -феніл	олія
231	H	Me	Me	Me	5-Me	-CH(CO ₂ Me)-	3-CF ₃ -феніл	олія
232	H	Et	H	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
233	Me	Me	Me	Me	H	Безпосередній зв'язок	5-Bu ¹ -1,3,4-оксадіазол-2-іл	олія
234	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4-толіл)-1,2,4-тіадіазол-5-іл	121-124
235	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-пропаргілоксифеніл	олія
236	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Br-2-піридил	олія
237	Me	Me	Me	H	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
238	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Br-феніл	олія
239	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Et-феніл	олія
240	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-біфеніл	олія

1	2	3	4	5	6	7	8	9
241	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-феніл	олія
242	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-MeS-феніл	олія
243	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Br-феніл	олія
244	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-бензоїлфеніл	олія
245	Me	Me	Me	Me	5-Me	O	4-пропіонілфеніл	олія
246	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
247	H	Me	Me	Me	H	O	5-CF ₃ -1,3,4-тіадіазол-2-іл	олія
248	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-(триметилсилілетиніл)-2-піридил	олія
249	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-етиніл-2-піридил	олія
250	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2,4-диCl-феніл	96-97
251	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Pr ^t -2-Me-феніл	олія
252	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4-Cl-феніл)-1,2,4-тіадіазол-5-іл	118-122
253	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3-NO ₂ -феніл)-1,2,4-тіадіазол-5-іл	125-128
254	Et	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
255	B	Me	Me	H	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	олія
256	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Pr ^t -3-Me-феніл	олія
257	H	Me	Me	H	H	O	3-Bu ^t -феніл	олія
258	H	Me	Me	Me	5-Me	O	9-оксофлуорен-2-іл	олія
259	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3,5-диCF ₃ -феніл)-1,2,4-тіадіазол-5-іл	112-115
260	H	Me	Me	Cl	H	O	3-Bu ^t -феніл	олія
261	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-бензилоксифеніл	олія
262	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-(4-Cl-феніл)-2-піридил	олія
263	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-НО-феніл	олія
264	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -бензил	75-7
265	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-(3-CF ₃ -фенілтіо)-піримідин-4-іл	олія
266	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-бензилоксифеніл	олія
267	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	циклогексил	олія
268	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ CH ₂ O-	4-Cl-феніл	олія
269	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ CH ₂ O-	4-Bu ^t -феніл	олія
270	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₄ O-	феніл	олія
271	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₄ -	фталімідо	олія
272	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₅ -	феніл	олія
273	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₃ O-	4-Bu ^t -феніл	олія
274	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₄ O-	4-Bu ^t -феніл	олія
275	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₄ O-	2-Bu ^t -феніл	олія
276	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	2-тетрагідропіраніл	олія
277	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₃ O-	феніл	олія
278	H	Me	Me	Me	5-Me	-O(CH ₂) ₉ O-	2-тетрагідропіраніл	олія
279	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	2-(1-метокси-карбоніл-2-метоксивініл)феніл	олія
280	H	Me	MeП	Me	5-Me	-OCH ₂ CH ₂ -	2-фенілетил	олія
281	H	Pr	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
282	H	Bu	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
283	H	Pr ^t	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
284	H	аліл	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
285	H	Bu	Et	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
286	H	Et	Et	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
287	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Bu ^t S-піримідин-4-іл	олія
288	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,3-diMe-2-EtO-2,3-дигідробензофуран-5-іл	олія
289	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-су ^t HexS-піримідин-4-іл	олія
290	H	Me	Me	Me	5-Me	-OCH ₂ -	4-циклогексилметилоксифеніл	олія
291	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Pr ^t -феніл	олія
292	H	Me	Me	Me	H	O	2-(2-феноксietокси)феніл	олія
293	H	CN	H	H	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	152-154
294	H	Me	Me	Cl	H	O	3-CF ₃ -феніл	олія
295	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-(2-феніл-етилтіо)піримідин-4-іл	олія

1	2	3	4	5	6	7	8	9
296	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(3-CF ₃ -бензилокси)феніл	олія
297	H	Me	Me	CF ₃	H	O	3-Bu ^t -феніл	олія
298	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(2-Cl-феніл)-тіазол-2-іл	олія
299	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(3-Cl-феніл)-тіазол-2-іл	122-125
300	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-CF ₃ -феніл)тіазол-2-іл	123-125
301	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3-CF ₃ -бензилокси)-феніл	олія
302	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-(4-Me-бутоксифеніл)	олія
303	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Pr ^t O-феніл	олія
304	H	Me	Me	Me	5-Me-6-NO ₂	O	3-Bu ^t -феніл	олія
305	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-(3-CF ₃ -бензилокси)феніл	олія
306	H	Me	Me	Me	H	O	2-(3-CF ₃ -бензилокси)феніл	олія
307	H	CN	H	Me	5-Me	O	3-Cl-феніл	134-135
308	H	CN	H	Me	5-Me	O	4-Pr ^t феніл	159-160
309	H	CN	H	Me	5-Me	O	3-MeO-феніл	104-108
310	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-Cl-феніл	олія
311	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-Pr ^t -феніл	олія
312	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-MeO-феніл	олія
313	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-(третпентил)феніл	олія
314	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-Me-ундецилокси) феніл	олія
315	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-Pr ^t O-феніл	олія
316	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,5-diPr ^t -феніл	олія
317	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-MeO-5-Me-феніл	олія
318	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3,5-диCF ₃ -феніл	олія
319	H	Me	Me	Me	5-Me	O	2-(1-Me-ундецилокси)феніл	олія
320	H	Me	Me	Me	H	O	2-(ізопентокси)-феніл	олія
321	H	Me	Me	Me	H	O	2-Pr ^t O-феніл	олія
322	H	Me	Me	Me	5-Me	O	6-Cl-бензоксазол-2-іл	118-120
323	H	CN	H	Me	5-Me	O	3-PhO-феніл	олія
324	H	CN	H	Me	5-Me	O	4-Bu ^t -феніл	олія
325	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3-PhO-феніл	олія
326	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-Bu ^t -феніл	олія
327	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Cl-бензоксазол-2-іл	190
328	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-NO ₂ -бензоксазол-2-іл	олія
329	H	аліл	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
330	H	Pr ^t	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
331	H	Bu	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	олія
332	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-НО-феніл	155-7
333	H	H	H	Me	5-Me	O	3,5-диCl-феніл	199-201
334	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-ілокс)феніл	олія
335	H	Et	Me	Me	5-Me	O	3,5-диCl-феніл	олія
336	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Br-бензтіазол-2-іл	олія
337	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-(4-CF ₃ -феніл)-бензтіазол-2-іл	131-133
338	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Ph-бензтіазол-2-іл	107-109
339	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-(4-CF ₃ O-феніл)бензтіазол-2-іл	138-140
340	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(ізопентокси)-феніл	олія
341	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(циклогексилметокси)-п-феніл	олія
342	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4-біфенілїлметокси)-феніл	олія
343	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(пропаргілокси)-феніл	олія
344	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(алілокси)-феніл	олія
345	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(PhO-етокси)феніл	олія
346	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(2-тієніл)феніл	олія
347	H	Me	Me	Me	5-Me, 6-Br	O	3-Bu ^t -феніл	олія
348	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(циклопропілметокси)феніл	олія
349	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(фенацилокси)-феніл	олія
350	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(метоксикарбонілметил)феніл	олія
351	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(3,4-диCl-феніл)тіазол-2-іл	121-123

1	2	3	4	5	6	7	8	9
352	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(бензилоксикарбонілметок- си)феніл	олія
353	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3-Cl-4-F-феніл)феніл	олія
354	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(тетрагідрофуран-2-іл- метокси)феніл	олія
355	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(тетрагідропиран-2- ілметокси)феніл	олія
356	H	Me	Me	Me	5-F	O	3-Ph-1-1,2,4-тіадіазол-5-іл	67-69
357	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(4-Cl-бензоіл)феніл	олія
358	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-[1-(етоксикарбоніл)- етокси]феніл	олія
359	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(2,2,2-трифлуоретокси)-феніл	олія
360	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4-CN-бутоксикарбоніл)-феніл	олія
361	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-CF ₃ -феніл	олія
362	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-CF ₃ -бензтіазол-2-іл	олія
363	H	Me	Me	Me	5-F	O	3-CF ₃ -феніл	олія
364	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-CF ₃ -феніл	олія
365	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-F-3-CF ₃ -феніл	олія
366	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-йодфеніл	олія
367	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-ацетоксифеніл	олія
368	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-CF ₃ -бензтіазол-2-іл	олія
369	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(4,6-диMe-піримідин-2- ілокси)феніл	олія
370	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
371	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-бензоіл-1-метилетокси)феніл	олія
372	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-етоксикарбоніл-2-метилпроп- 1-ілокси)феніл	олія
373	H	CN	Me	Me	5-Me	O	4-Cl-3-CF ₃ -феніл	олія
374	H	Et	CN	Me	5-Me	O	4-Cl-3-CF ₃ -феніл	олія
375	H	Ac	CN	Me	5-Me	O	4-Cl-3-CF ₃ -феніл	олія
376	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-ацетилетокси)феніл	олія
377	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-етилпропокси)феніл	олія
378	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-циклопентилфеніл	олія
379	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(3,5-диCl-2-піридилокси)феніл	олія
380	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-[етоксикарбоніл(N-метоксііміно)- метокси]феніл	олія
381	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-(2-CF ₃ -бензоіл)феніл	олія
382	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-гексилфеніл	олія
383	H	Me	Me	Me	5-Me	O	5-Ph-тіазол-2-іл	олія
384	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(2,2-диметоксиетокси)феніл	олія
385	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(2,2-діетоксиетокси)феніл	олія
386	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3[2-(3-Bu ^t -фенокси)-етокси]феніл	олія
387	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3[2-(4-F-фенокси)етокси]феніл	102-104
388	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ SO ₂ O-феніл	олія
389	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Br-3-Cl-феніл	86-88
390	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(2-Me-2-фенілпропіл)-феніл	олія
391	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-HO-1-Me-етил)феніл	олія
392	H	Me	Me	Me	5-Me	O	3-(1-MeO-1-Me-етил)феніл	олія
393	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-F-3-CF ₃ -феніл	олія
394	H	Me	Me	Me	5-Me	O	4-Me-3-CF ₃ -феніл	олія
395	H	Et	Me	Me	5-Me	O	4-Me-3-CF ₃ -феніл	олія
396	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	5-Me	O	3-Bu ^t -феніл	олія
397	H	H	CN	Me	Me	O	3-CF ₃ -4-Cl-феніл-	111-114
398	H	Me	Me	Me	Me	C=O	3-CF ₃ -феніл	олія

Сполуки таблиці 1, які не мають окремих температур плавлення, мають характеристичні ¹H ЯМР, представлені в таблиці 2 нижче.

Таблиця 2

Спол.	Дані
2	1,78 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
3	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,95 (с, 2H, SCH ₂)
4	2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
5	1,70 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,90 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,90 (с, 2H, SCH ₂)
6	1,80 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
7	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
9	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
10	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,10 (с, 2H, ArCH ₂)
12	2,17 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
13	2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
14	3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
17	2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 2,99 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,00 (с, 2H, ArCH ₃)
18	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (ушс, 6H, N(CH ₃) ₂)
19	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
20	2,15 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
21	1,15 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (м, 7H, CH и N(CH ₃) ₂)
22	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,04 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
23	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
24	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
25	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
26	2,14 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,82 (с, 3H, OCH ₃), 3,96 (с, 3H, OCH ₃)
27	2,14 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,93 (с, 3H, OCH ₃)
28	2,13 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
29	2,08 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
31	2,07 (с, 3H, ArCH ₃), 2,11 (с, 6H, ArCH ₃), 2,36 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
32	2,08 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
33	1,38 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,09 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,03 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,35 (кв, 2H, CH ₂)
34	(с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,26 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
35	2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,45-3,55 (уш., 4H, CH ₂), 3,75 (д, 4H, CH ₂)
37	1,20 (т, 6H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,30-3,50 (уш., 4H, CH ₂ CH ₃)
38	0,95 (т, 6H, CH ₂ CH ₃), 1,70 (уш., 4H, CH ₃ CH ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,10-3,50 (уш., 4H, NCH ₂)
39	1,00 (т, 6H, CH ₂ CH ₃), 1,35 (кв, 4H, CH ₂ CH ₃), 1,60 (кв, 4H, NCH ₂ CH ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,15-3,45 (уш., 4H, NCH ₂)
40	1,3 (д, 12H, CCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,6-4,9 (уш., 2H, CH)
42	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,55 (с, 3H, NCH ₃)
43	1,55-1,75 (м, 6H, CH ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,4 0 (уш., 4H, NCH ₂)
45	1,20 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (уш., 2H, NCH ₂)
50	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
51	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
52	2,18 (с, 6H, ArCH ₃), 2,98 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
53	2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
56	2,09 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂) и 3,77 (с, 3H, OCH ₃)
65	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃) и 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
67	1,15 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂) и 3,43 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
70	2,20 (с, 6H, ArCH ₃), 1,85 (с, 3H, CH ₃), 1,90 (с, 3H, CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,35 (с, 3H, NCH ₃)
71	2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,28 (с, 3H, ArCH ₃) и 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
74	2,06 (с, 3H, ArCH ₃), 2,13 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂) и 3,35 (с, 3H, CONCH ₃)
81	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, N(CH ₃) ₂)
83	2,21 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
85	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,97 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
90	2,16 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
92	1,00 (т, 6H, (NCH ₂ CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,35 (м, 4H, N(CH ₂ CH ₃) ₂)
93	2,20 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
94	2,20 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
95	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
99	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,30 (м, 6H, ArCH ₃)

1	2
100	1,20 (т, 3H, NCH ₂ CH ₃), 1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (уш., 2H, NCH ₂ CH ₃)
104	2,12 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,37 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (C, 6H, N(CH ₃) ₂)
105	1,30 (д, 6H, CHCH ₃), 2,16 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,43 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
108	1,30 (с, 3H, C(CH ₃) ₃), 1,95 (с, 3H, CCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
109	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
110	1,00 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
113	1,31 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,03 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
115	1,74 (с, 3H, пиррCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,23 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
119	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,6 (с, 3H, SCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
121	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,39 (с, 3H, ArCH ₃), 2,99 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,42 (с, 3H, NCH ₃)
123	1,4 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (C, 6H, N(CH ₃) ₂)
124	0,88 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,27 (д, 3H, CHCH ₃), 1,66 (м, 2H, CHCH ₂ CH ₃), 2,14(с, 3H, ArCH ₃), 2,20(с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,19(м, 1H, CHCH ₃)
125	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
126	2,20-2,22 (м, 9H, ArCH ₃ , CH=CCH ₃), 3,04 (S, 6H, N(CH ₃) ₂)
128	2,26 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,07 (с, 2H, NCH ₂)
129	1,10 (т, 6H, N(CH ₂ CH ₃) ₂), 2,12 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (C, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,22 (кв, 4H, N(CH ₂ CH ₃) ₂)
130	0,82 (т, 3H, CHCH ₃), 1,21 (д, 3H, CHCH ₃), 1,57 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,54 (кв, 1H, CHCH ₃), 3,01 (C, 6H, N(CH ₃) ₂)
134	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,23 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
135	2,08 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,04 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
136	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,90-3,00 (м, 12H, 2xN(CH ₃) ₂)
137	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
138	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,1 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
139	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
140	1,35 (т, 3H, OCH ₂ CH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,28 (с, 3H, SCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,35 (кв, 2H, OCH ₂ CH ₃)
141	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, NCH ₃)
142	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
143	1,85 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, NCH ₃)
148	2,09 (с, 3H, ArCH ₃), 2,26 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
149	1,20 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,12 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,85 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
150	2,09 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,57 (с, 3H, COCH ₃), 3,03 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
151	0,75 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,35 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 1,70 (с, 2H, CCH ₂ C), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
152	1,21 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,83 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
153	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, 3,0, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
154	0,9 (м, 9H, CH ₃ (CH ₂) ₃), 1,6 (м, 2H, CH ₂), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,74 (м, 2H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
155	2,25 (с, 6H, ArCH ₃), 2,55 (с, 6H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
156	2,0 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,8 (C, 2H, CH ₂)
157	1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,85 (с, 2H, CH ₂)
158	1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,85 (м, 5H, OCH ₃ ,CH ₂)
159	2,3 (с, 6H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
160	2,2 (с, 6H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
161	1,2-1,9 (м, 10H, циCH ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,6 (м, 1H, CH), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
162	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
163	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
164	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
165	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 2,5 (с, 3H, CH ₃), 2,75 (с, 3H, CH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
166	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,7 (с, 3H, CH ₃)
167	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
168	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,15 (с, 3H, OCH ₃)

1	2
169	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
170	0,70 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 1-60 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, NCH ₃)
171	1,20 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,60 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
172	0,70 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (с, 6H, CH ₃), 1,60 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 1,80 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
173	2,09 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
174	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 9H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
176	2,23 (с, 3H, ArCH ₃), 2,35 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
177	2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 2,34 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 6,74 (д, 1H, тиофн), 6,84 (д, 1H, ткофн)
180	0,45-1,75 (м, 19H, C ₉ H ₁₉), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
181	1,21 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,60 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
182	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,04 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
183	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
184	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 2,40 (с, 3H, SCH ₃)
185	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
186	1,60 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
190	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
191	1,00 (т, 6H, N(CH ₂ CH ₃) ₂), 1,76 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,97 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,35 (м, 4H, N(CH ₂) ₂)
196	2,16 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,96 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
197	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,23 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
198	1,20 (д, 6H, CHCH ₃) ₂ , 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,30 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂)
199	1,25 (д, 3H, CHCH ₃), 1,85 (с, 3H, =CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,40 (кв, 1H, CHCH ₃)
200	1,10 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,60 (с, кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
201	1,15 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,80 (с, 3H, =CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,65 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
202	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,233 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (с, 3H, SCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
203	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
204	1,20 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,08 (с, ArCH ₃), 2,20 (с, ArCH ₃), 2,92 (кв, CH ₂ CH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
207	2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
208	1,20 (с, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,30 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂)
209	1,85 (с, 3H, NCCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,10 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
210	1,47 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 2,32 (с, 3H, ArCH ₃), 3,04 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
213	2,13 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
214	2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,2 (с, 1H, CHCN)
215	2,16 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 2,97 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
216	2,10-2,25 (м, 9H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
217	2,17 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 2,99 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,78 (с, 3H, OCH ₃)
219	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
220	2,20 (с, 6H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,18 (с, 2H, ArCH ₂ O)
221	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,92 (с, 2H, OCH ₂ O)
222	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,27 (с, 6H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
223	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,73 (с, 6H, OCH ₃)
224	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
225	1,25 (м, 3H, NCH ₂ CH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 2,35 (м, 2H, NCH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃)
227	2,35 (м, 6H, ArCH ₃) ₂
230	1,22 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,82 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,03 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,30 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂)
231	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,7 (с, 3H, OCH ₃), 5,1 (с, 1H, CHCO ₂ CH ₃)
232	1,30 (т, 3H, NCH ₂ CH ₃), 2,30 (м, 8H, Ar(CH ₃) ₂), +NCH ₂ CH ₃ , 3,45 (уш., 1H, NH)
233	1,47 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,79 (с, 3H, N=CCH ₃), 2,15 (с, 3H, □H), 3,06 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
235	2,12 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,50 (м, 1H, CH ₂ CCH), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,60 (д, 2H, CH ₂ CCH)

1	2
236	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
237	1,90 (с, 3H, NCCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,10 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
238	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,02 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
239	1,15 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,05 (с, ArCH ₃), 2,54 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
240	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,05 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
241	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,02 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
242	1,80 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,02 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (с, 3H, SCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
243	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,00 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
244	1,75 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,00 (с, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
245	1,15 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,78 (с, 3H, N=CCH ₃), 1,93 (с, 3H, ArCH ₃), 1,99 (с, ArCH ₃), 2,88 (с, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
246	1,70 (м, 6H, CH ₂ CH ₂ CH ₂), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,50 (м, 4H, CH ₂ NCH ₂)
247	2,3 (с, 3H, ArCH ₃), 3,04 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
248	0,20 (с, 9H, Si(CH ₃) ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
249	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,1 (с, 1H, CCH)
251	1,15 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,30 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂)
254	1,00 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
255	1,05 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (м, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
256	1,10 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, NCH ₃), 3,30 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂)
257	0,85 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 3,00 (с, 6H, CH(CH ₃) ₃)
268	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,21 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
260	1,00 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
261	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,00 (с, 2H, (OCH ₂ Ph))
262	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
263	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,03 (с, 6H, 2N(CH ₃) ₂)
265	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
266	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, CH(CH ₃) ₂), 5,00 (с, 2H, CH ₂)
267	0,9-1,3 (м, 5H), 1,6-1,8 (м, 6H), 2,1 (с, 3H), 2,15 (с, 3H), 3,6 (д, 2H), 2,95 (д, 6H)
268	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,2 (м, 4H, O(CH ₂) ₂ O)
269	1,2 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,1-4,25 (уш., 4H, O(CH ₂) ₂ O)
270	1,85-2,0 (м, 4H, CH ₂ CH ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,8-4,0 (м, 4H, OCH ₂ , OCH ₂)
271	1,65-1,9 (м, 4H, (CH ₂) ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,65-3,9 (м, 4H, OCH ₂ , NCH ₂)
272	1,4-1,8 (м, 6H, (CH ₂) ₃), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,8 (м, 4H, OCH ₂ , ArCH ₂)
273	1,2 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,90 (м, 2H, CH ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,95-4,1 (м, 4H, (CH ₂) ₃)
274	1,1-1,2 (м, 2H, CH ₂), 1,3 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,9-2,0 (м, 2H, CH ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,9-4,0 (м, 4H, OCH ₂ , OCH ₂)
275	1,25 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,9 (уш.с, 4H, (CH ₂) ₂), 2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,8-4,0 (уш.д, 4H, O(CH ₂), OCH ₂)
276	1,35-1,8 (м, 6H, (CH ₂) ₃), 2,1 (д, 6H, Ar(CH ₃) ₂), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,45 (м, 1H, CH), 3,6-4,0 (м, 1H, OCH ₂ , OCH ₂)
277	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 2H, CH ₂), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,05 (м, 2H, CH ₂), 4,1 (м, 2H, CH ₂)
278	1,2-1,8 (м, 2OH, (CH ₂) ₁₀), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,3 (м, 1H, CH), 3,45 (м, 1H, CH), 3,7 (м, 1H, CH), 3,8-3,9 (м, 3H, CH+CH ₂), 4,5 (м, 1H, CH)
279	2,15 (д, 6H, (ArCH ₃) ₂), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,6 (с, 3H, OCH ₃), 3,75 (с, 3H, COOCH ₃), 4,8 (с, 2H, CH ₂)
280	2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,9 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,0 (м, 2H, CH ₂), 4,05 (м, 2H, CH ₂)
281	0,95 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,30 (с, 9H, CCH ₃), 1,65 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 3H, NCH ₃), 3,30 (м, 2H, NCH ₂)
282	0,90 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,20 (с, 9H, CCH ₃), 1,30 (м, 2H, CH ₂ CH ₂), 1,50 (м, 2H, CH ₂ CH ₂), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,90 (с, 3H, NCH ₃), 3,20 (м, 2H, NCH ₂)

Продовження таблиці 2

1	2
283	1,25 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,90 (с, 3H, N(CH ₃) ₂), 3,70 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
284	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,95 (м, 2H, NCH ₂), 5,25 (д, 2H, CH=CH ₂), 5,90 (м, 1H, CH=CH ₂)
285	1,00 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,30 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 1,40 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 1,65 (м, 2H, CH ₂ CH ₂), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,40 (м, 4H, NCH ₂ , NCH ₂)
286	1,15 (т, 6H, (CH ₂ CH ₃) ₂), 1,20 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 3,35 (м, 4H, N(CH ₂ CH ₃) ₂)
287	1,50 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
288	1,21 (м, 9H, CH ₂ CH ₃ , C(CH ₃) ₃), 2,15 (д, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₃), 3,61 (м, 1H, CH ₂ CH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,92 (м, 1H, CH ₂ CH ₃)
289	1,20-1,80 (м, 10H, C ₆ H ₁₀), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,90 (м, 1H, SCH)
290	0,80-2,00 (м, 11H, C ₆ H ₁₁), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,18 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,70 (д, 2H, OCH ₂ C ₆ H ₁₁)
291	1,30 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,45 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
292	2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,20 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂ O), 4,35 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂ O)
294	3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
295	2,00 (м, 6H, (ArCH ₃) ₂), 2,95 (м, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,30 (м, 2H, ArCH ₂ CH ₂), 4,05 (м, 2H, ArCH ₂ CH ₂)
296	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,05 (с, 2H, ArCH ₂ O)
297	1,25 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
298	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
301	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,05 (с, 2H, ArCH ₂ O)
302	0,90 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,70 (м, 2H, CH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,78 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 2,15 (с, 6H, Ar(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,03 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂)
303	1,33 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,42 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
304	1,00 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 3,15 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
305	2,20 (с, 6H, Ar(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,20 (с, 2H, ArCH ₂ O)
306	2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,15 (с, 2H, ArCH ₂ O)
310	1,20 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, CH ₂ CH ₃)
311	1,25 (м, 9H, CH ₂ CH ₃ +CH(CH ₃) ₂), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 2,90 (кв, 1H, CH(CH ₃) ₂), 3,05 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, CH ₂ CH ₃)
312	1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,75 (с, 3H, OCH ₃)
313	0,70 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,30 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 1,65 (кв, 2H, CH ₂ CH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (уш, 2H, NCH ₂)
314	0,70-1,70 (м, 24H, C ₁₀ H ₂₁ +CHCH ₃), 2,02 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,20 (м, 1H, OCH(CH ₃)C)
315	1,30 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,18 (с, 6H, Ar(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,55 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
316	1,10 (д, 12H, CH(CH ₃) ₂), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
317	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 2,26 (с, 3H, ArCH ₃), 3,01 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,47 (с, 3H, OCH ₃)
318	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,19 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
319	0,75-1,85 (м, 24H, C ₁₀ H ₂₁ +CHCH ₃), 2,18 (с, 6H, Ar(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,38 (м, 1H, C ₁₀ H ₂₁ CHCH ₃)
320	0,90 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,60 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂ CH), 1,70 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,00 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂)
321	1,30 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,50 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂)
323	2,20 (м, 6H, ArCH ₃), 8,60-8,35 (м, 1H, NH)
324	1,30 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 2,25 (м, 6H, ArCH ₃), 8,30-8,60 (м, 1H, NH)
325	1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, CH ₂ CH ₃)
326	1,30 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, NCH ₂ CH ₃)
328	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,24 (с, 3H, ArCH ₃), 3,02 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
329	2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 3H, NCH ₃), 3,85 (м, 2H, NCH ₂), 5,15 (д, 2H, CHCH ₂), 5,80 (м, 1H, CHCH ₂)
330	1,20 (д, 3H, CH(CH ₃) ₂), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,85 (с, 3H, NCH ₃), 3,60 (м, 1H, CHCH ₃)

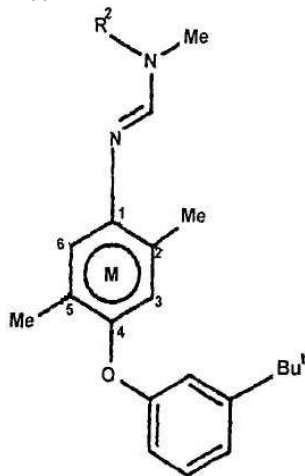
Продовження таблиці 2

1	2
331	0,90 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,30 (м, 2H, CH ₂ CH ₂), 1,55 (м, 2H, CH ₂ CH ₂), 2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 3H, NCH ₃), 3,20 (м, 2H, NCH ₂)
334	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
335	1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, CH ₂ CH ₃)
336	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
340	0,93 (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,60 (т, 2H, OCH ₂ CH ₂ CH), 1,80 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,90 (т, 2H, OCH ₂ CH ₃)
341	0,70-1,85 (м, 11H, C ₆ H ₁₁), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,13 (с, 3H, ArCH ₃), 2,92 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,60 (д, 2H, OCH ₂ Ar)
342	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,23 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,00 (с, 2H, OCH ₂ Ar)
343	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,50 (д, 1H, CH ₂ CCH), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,60 (д, 2H, OCH ₂ CCH)
344	2,12 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,45 (д, 2H, OCH ₂ CHCH ₂), 5,22-5,42 (м, 2H, OCH ₂ CHCH ₂), 6,00 (м, 1H, OCH ₂ CHCH ₂)
345	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,25 (уш.с, 4H, ArOCH ₂ CH ₂ O)
346	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,30 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
347	1,25 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (уш, 6H, N(CH ₃) ₂)
348	0,30 (м, 2H, цич ₂), 0,60 (м, 2H, цич ₂), 1,20 (м, 1H, цич), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 6H, N(CH ₃) ₂), 3,72 (д, 2H, OCH ₂ C ₃ H ₅), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
349	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 5,20 (с, 2H, COCH ₂ O)
350	2,07 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,75 (с, 3H, OCH ₃), 4,52 (с, 2H, COCH ₂ O)
352	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,60 (с, 2H, COCH ₂ O), 5,20 (с, 2H, PhCH ₂ O)
353	2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,30 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
354	1,60-2,30 (м, 4H, ТГФ), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,70-4,00 (м, 4H, ТГФ+OCH ₂), 4,20 (м, 1H, ТГФ)
355	1,20-1,95 (м, 6H, ТГП), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,40-4,10 (м, 5H, ТГП+OCH ₂)
357	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
358	1,10 (т, 3H, OCH ₂ CH ₃), 1,60 (д, 3H, CHCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,20 (кв, 2H, OCH ₂ CH ₃), 4,60 (кв, 1H, CHCH ₃)
359	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,25 (кв, 2H, OCH ₂ CF ₃)
360	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (м, 4H, OCH ₂ CH ₂ CH ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,40 (т, 2H, CH ₂ CH ₂ CN), 3,90 (т, 2H, OCH ₂ (CH ₂) ₃)
361	2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
362	1,00 (с, 9H, CH(CH ₃) ₃), 2,00 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
363	2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
364	1,2 (т, 3H, NCH ₂ CH ₃), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3 (с, 3H, NCH ₃), 3,35 (уш., 2H, NCH ₂ CH ₃)
365	2,1 (с, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
366	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,0 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
367	2,00 (с, 3H, CH ₃ CO), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,98 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
368	2,00 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
369	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (с, 6H, Гет(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
370	0,90 (д, 6H, CH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,80 (м, 1H, CH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (д, 2H, CH ₂ CH(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
371	1,60 (т, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,95 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,95 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
372	1,05 (т, 6H, CH(CH ₃) ₂), 1,25 (т, 3H, OCH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,23 (м, 1H, CH(CH ₃) ₂), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,20 (кв, 2H, OCH ₂ CH ₃)
373	2,1 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,35 (с, 3H, NCH ₃)
374	1,45 (т, 3H, NCH ₂ CH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,2 (с, 3H, ArCH ₃), 3,8 (кв, 2H, NCH ₂ CH ₃)
375	2,15 (с, ArCH ₃), 2,25 (с, ArCH ₃), 2,6 (с, 3H, NC(O)CH ₃)
376	1,45 (д, 3H, CHCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,22 (с, 3H, COCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,55 (кв, 1H, OCHCH ₃)
377	0,93 (м, 6H, (CHCH ₂ CH ₃) ₂), 1,60 (м, 4H, (CHCH ₂ CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,00 (м, 1H, OCH)
378	1,5-2,9 (м, 9H, цип), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,30 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
379	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
380	1,22 (т, 3H, OCH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,00 (с, 3H, OCH ₃), 4,25 (кв, 2H, OCH ₂ CH ₃)

1	2
381	2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
382	0,85 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,25 (м, 6H, CH ₂ CH ₂), 1,55 (м, 2H, ArCH ₂ CH ₂), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,50 (т, 2H, CH ₂ CH ₃), 3,00 (с, 6H, NCH ₃)
383	2,00 (с, 6H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
384	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,45 (с, 6H, (OCH ₃) ₂), 3,93 (д, 2H, OCH ₂), 4,68 (т, 1H, (CH ₃ O) ₂ CHCH ₂)
385	1,23 (т, 6H, (CH ₃ CH ₂ C) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,55-3,80 (м, 4H, (CH ₃ CH ₂ O) ₂), 3,95 (д, 2H, OCH ₂), 4,78 (т, 1H, (CH ₃ CH ₂ O) ₂ CH)
386	1,32 (с, 9HCH(CH ₃) ₃), 2,13 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 4,30 (м, 4H, OCH ₂ CH ₂ O)
388	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
390	1,30 (с, 6H, PhC(CH ₃) ₂), 2,05 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,80 (с, 2H, PhCCH ₂), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
391	1,55 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
392	1,50 (с, 6H, C(CH ₃) ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂), 3,05 (с, 3H, OCH ₃)
393	1,25 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (уш, 2H, CH ₂ CH ₃)
394	2,00 (с, 3H, ArCH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)
395	1,20 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,40 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, N(CH ₃) ₂), 3,40 (уш, 2H, NCH ₂)
396	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,90 (м, 4H, CH ₂ CH ₂), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,5 (м, 4H, CH ₂ NCH ₂)
397	2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 6H, N(CH ₃) ₂)

Приведені далі сполуки формули 1b (див. Таблицю 3), тобто сполуки загальної формули I, у яких R¹ представляє гідроген, R³ представляє метил, R⁴ представляє метил, R⁵ представляє метил, заміщений у положенні 5 фенільного кільця, -A-R⁶ знаходиться в пара-положенні відносно

амідинового фрагмента і представляє 3-Bu^t-феноксигрупу, можна отримати за аналогічними методиками прикладів 1-17, де фрагмент, зображений з правої сторони зв'язку A, приєднаний до R⁶.



(Ib)

Таблиця 3

Сполуки	R ²	Т.пл./°C
501	1-Ме-піперидин-4-іл	олія
502	2-диметиламіноетил	олія
503	Етоксикарбонілметил	олія
504	Пропаргіл	олія
505	2,2-диметоксіетил	олія
506	2-дигідроксіетил	олія
507	Циклопропіл	олія
508	Циклогексил	олія

Сполуки Таблиці 3, у яких немає температур плавлення, мають характеристичні ^1H ЯМР, які представлені в таблиці 4 нижче.

Таблиця 4

Спол	Дані
501	1,25 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 1,70-2,05 (м, 8H, циCH ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,30 (с, 3H, NCH ₃), 2,90 (с, 3H, NCH ₃)
502	1,20 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 6H, CH ₂ N(CH ₃) ₂), 2,45 (м, 2H, NCH ₂), 3,00 (с, 3H, NCH ₃), 3,40 (м, 2H, NCH ₂)
503	1,00 (т, 3H, CH ₂ CH ₃), 1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,10 (с, 3H, NCH ₃), 4,15 (с, 2H, NCH ₂), 4,25 (кв., 2H, CH ₂ CH ₃)
504	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,15 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 2H, ArCH ₃), 2,30 (с, 1H, CHC), 3,10 (с, 3H, NCH ₃), 4,20 (с, 2H, NCH ₂)
505	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 2,25 (с, 3H, ArCH ₃), 3,15 (с, 3H, NCH ₃), 3,50 (с, 6H, OCH ₃), 3,60 (м, 2H, NCH ₂), 4,60 (м, 1H, CH)
506	1,20 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,05 (с, 3H, NCH ₃), 3,55 (с, 2H, OCH ₂), 3,80 (с, 2H, NCH ₂), 5,95 (м, 1H, OH)
507	1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 0,60 (с, 2H, циCH ₂), 0,70 (с, 2H, циCH ₂), 2,10 (с, 3H, ArCH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃)
508	0,85-1,90 (м, 10H, циCH ₂), 1,30 (с, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,15 (с, 3H, CH ₃), 2,20 (с, 3H, ArCH ₃), 3,00 (с, 3H, NCH ₃)

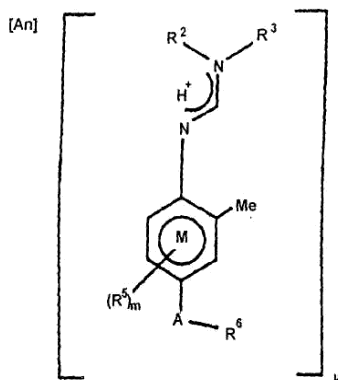
Приклад 18

Сульфатна сіль N,N-диметил-N'-[4-(3-трифлуорметилфенокси)-2,5-ксиліліформамідину (Сполука 602)

До розчину сполуки 1 (див. таблицю 1) (0,3г) в етанолі (0,3мл) краплями додають концентровану сульфатну кислоту (0,098г). Суміш фільтрують, отриману тверду речовину промивають діетиловим етером, у результаті одержують зазначену в заголовку сполуку у вигляді твердої

речовини, т. пл. 178-180°C.

Приведені далі сполуки формули X (див. таблицю 4), тобто солі загальної формули I, у яких -A-R⁶ знаходиться в пара-положенні відносно амідинового фрагмента, R¹ представляє гідроген, R⁴ представляє метил, An⁻ представляє аніон і u дорівнює 1 або 2 у залежності від валентності аніона, можна отримати за методиками, аналогічними прикладу 18.



(X)

Таблиця 4

Сполука	R ²	R ³	(R ⁵) _m	A	R ⁶	An ⁻	т.пл./°C
600	Me	Me	5-Me	-O-CH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	сульфат	215-217
601	Me	Me	5-Me, 6-Br	O	3-CF ₃ -феніл	сульфат	114-118
602	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	сульфат	178-180
603	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	хлорид	152-154
604	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	п-толуолсульфонат	133-135
605	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	Сахаринат	олія
606	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	Трифлуорацетат	141-143
607	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	Метансульфонат	151-153
608	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	Оксалат	184-186
609	Me	Me	5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	Кампосульфонат	олія
610	-(CH ₂) ₄ -		5-Me	O	3-CF ₃ -феніл	хлорид	159-163
611	Me	Me	5-Me	O	3-Ph-1,2,4-тіадіазол-5-іл	хлорид	80

Сполуки таблиці 4, у яких немає температур плавлення, мають наступні характеристичні дані ^1H ЯМР у CDCl_3 .

Сполука 605

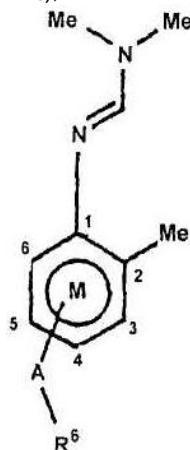
^1H ЯМР δ (м.д.) 2,15 (с, 3H, ArCH_3), 2,25 (с, 3H, ArCH_3), 3,20 (с, 3H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$), 3,25 (с, 3H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$), 10,20-10,80 (уш. 1H, NH).

Сполука 609

^1H ЯМР δ (м.д.) 0,75 (с, 3H, CCH_3), 1,05 (с, 3H, CCH_3), 1,25 (д, 2H, CH_2), 1,75-1,95 (м, 3H), 2,15 (с, 3H, ArCH_3), 2,20 (м, 1H, CH), 2,25 (с, 3H, ArCH_3),

2,35 (д, 1H, CH), 2,60 (т, 1H, CH), 2,85 (д, 1H, CH), 3,20 (с, 3H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$), 3,30 (с, 3H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$).

Приведені далі сполуки формули Ic (див. таблицю 5), тобто сполуки загальної формули I, у яких R^1 і R^5 представляють гідроген, R^2 , R^3 і R^4 представляють метил, можна отримати за аналогічними методиками прикладів 1-17, де фрагмент, зображений з правої сторони зв'язку А, приєднаний до R^6 .



(Ic)

Таблиця 5

Сполука	Положення -A-R ⁶	A	R ⁶	Дані (т.пл./°C або ^1H ЯМР)
700	5	-OCH ₂ -	3-CF ₃ -феніл	2,00 (с, 3H, ArCH_3), 3,00 (с, 6H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$), 5,05 (с, 2H, ArCH_3)
701	5	-OCH ₂ -	4-Bu ¹ -феніл	85-87°C
702	3	-O-	3-CF ₃ -феніл	2,10 (с, 3H, ArCH_3), 3,00 (с, 6H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$)

Приклади випробувань

Сполуки згідно з цим винаходом були випробувані на активність у відношенні одного або декількох з таких збудників хвороб:

Phytophthora infestans: фітофлуроз томатів

Plasmopara viticola: несправжня борошниста роса винограду

Erysiphe graminis f. sp. tritici: справжня борошниста роса пшениці

Pyricularia oryzae: пірикуляріоз рису

Leptosphaeria nodorum: плямистість колоскової луски

Водні розчини або дисперсії сполук у потрібній концентрації, які включають змочувальний агент, наносять обприскуванням або змочуванням основи стебла рослин, які тестують, як це підходить. Через визначений час рослини або частини рослин інокулюють відповідними патогенами, які тестують, до або після застосування сполук, як це підходить, і витримують у контрольованих умовах навколишнього середовища, які підходять для підтримки росту рослини і розвитку хвороби. Після закінчення відповідного часу візуально визначають ступінь зараження uszkodженої частини рослини. Сполуки оцінюють по шкалі від

1 до 3, де 1 означає невеликий або відсутність контролю, 2 означає середній контроль, і 3 означає гарний або повний контроль. У концентрації 500ч/млн (мас/об.) або менше активність з оцінкою 2 або більше у відношенні зазначених грибків виявили такі сполуки:

Phytophthora infestans

7, 8, 28, 30, 36, 46 і 271.

Plasmopara viticola

149,331, 373 і 364.

Erysiphe graminis f. sp. tritici

1-5, 7-9, 11-13, 15-24, 26, 28-41, 43, 45, 46, 48, 51, 52, 55, 56, 58, 59, 61, 62, 65, 68, 76, 84, 86, 90, 100, 101, 104-106, 109, 112, 113, 120, 123, 124, 130, 135, 138, 139, 140, 141, 143, 146, 149, 160, 166, 171, 173-175, 183, 187-190, 193-196, 200, 203-205, 207-209, 213, 215-217, 223, 225, 228,231, 232, 234, 237, 246, 250, 252, 253, 256, 258, 259, 261, 262, 264, 266-272, 277, 279, 281, 282, 284, 286-288, 290, 291, 295, 298, 299, 301, 303, 310-312, 318, 325, 326, 330, 331, 335, 346, 347, 349, 351, 353, 355-357, 359, 361, 364, 365-368, 370-372, 374, 376-379, 392, 396, 398, 502, 504, 600, 601, 610 і 611.

Pyricularia oryzae

65

7, 17, 20, 21, 23, 26-28, 30, 32, 34, 36, 38, 41,
43, 45, 51, 54, 55, 59, 63, 94, 140, 143, 146, 163,
225, 325, 352, 353, 360, 368, 600 і 611.
Leptosphaeria nodorum

70991

66

1, 2, 5, 7, 8, 15, 27, 29, 35, 37, 41, 43, 45, 48,
56, 59, 61, 72, 100, 130, 160, 170, 181, 194, 208,
214, 235, 246, 283, 284, 290, 303, 310, 311, 312,
325, 326, 351, 364, 369, 378 і 392.