



УКРАЇНА

(19) UA (11) 89000 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 401/04 (2008.01)

A01N 43/54 (2008.01)

A01N 43/90

A01P 3/00

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

(54) СПОЛУКА 2-(ПІРИДИН-2-ІЛ)-ПІРИМІДИНУ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З ФІТОПАТОГЕННИМИ ГРИБАМИ

1

2

(21) а200812906

(22) 11.04.2007

(24) 10.12.2009

(86) РСТ/ЕР2007/053516, 11.04.2007

(31) 06007744.3

(32) 12.04.2006

(33) ЕР

(46) 10.12.2009, Бюл. № 23, 2009 р.

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

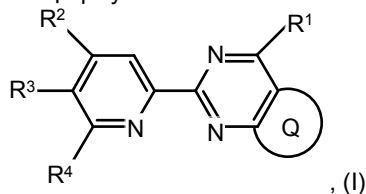
(73) БАСФ СЕ, DE

(56) UA а2007 01582, А, 15.03.2007

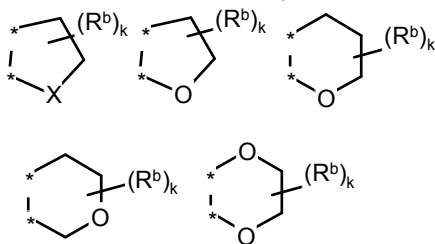
WO 2006010570, А, 02.02.2006

EP 0 259 139, А, 09.03.1988

JP 4224580, А, 13.08.1992

TETRAHEDRON LETTERS, 04.03.2000, Vol. 41, No.  
10, pp. 1653-1656(57) 1. Сполука 2-(піридин-2-іл)-піримідину загаль-  
ної формули I

в якій

Q означає конденсований, насичений 5-, 6- або 7-  
членний карбоцикл формули

в якій

\* означає атоми піримідинового кільця, до якого  
прив'язаний Q;

k означає 0, 1 або 2;

R<sup>b</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл; iX означає (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> з n=1, 2 або 3 і причому, якщо  
k ≠ 0, то 1 або 2 атоми водню можуть бути замі-  
нені за допомогою R<sup>b</sup>,R<sup>1</sup> означає водень;R<sup>2</sup> означає водень;R<sup>3</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл;R<sup>4</sup> означає феніл, 5-членний гетероарил, який як  
кільцевий атом має 1 гетероатом, вибраний з азо-  
ту, кисню та сірки, або 6-членний гетарил, який  
має 1 або 2 атоми азоту як кільцеві члени, причо-  
му феніл, 5- та 6-членний гетарил можуть мати 1,  
2 або 3 замісники R<sup>a</sup>, причомуR<sup>a</sup> вибраний з галогену, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілу, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
алкокси, і залишків формули C(=Z)R<sup>aa</sup>, в якій Z  
означає O або N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси) і R<sup>aa</sup> означає C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>-алкіл;і застосовні в сільському господарстві солі сполук  
формули I;за винятком сполук формули I, в якій R<sup>2</sup> означає  
водень, R<sup>4</sup> означає феніл, який при необхідності  
має 1, 2 або 3 замісники R<sup>a</sup> і Q означає конденса-  
ваний, насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл,  
який є незаміщеним або має 1, 2, 3 або 4 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
алкільні групи як замісники, і застосовні в сільсь-  
кому господарстві солі цієї сполуки.2. Сполука за п. 1, в якій R<sup>3</sup> означає метил.3. Сполука за п. 1, в якій R<sup>4</sup> вибраний з 5-членного  
гетероарилу, який як кільцевий член має 1 гетеро-  
атом, вибраний з азоту, кисню і сірки, і 6-членного  
гетарилу, який як кільцеві члени має 1 або 2 атоми  
азоту, причому 5- і 6-членний гетарил можуть мати  
1, 2 або 3 замісники R<sup>a</sup>, причому R<sup>a</sup> вибраний з  
галогену, метилу, метокси, ацетилю і C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
алкоксиміноетилю;4. Сполука за п. 3, в якій R<sup>4</sup> вибраний з фурилу,  
тієнілу, піридінілу і піримідинілу, які кожного разу є  
незаміщеними або мають 1, 2 або 3 замісники R<sup>a</sup>.5. Сполука за п. 4, в якій гетероароматичний за-  
лишок R<sup>4</sup> має принаймні один замісник і/або при-  
наймні один вибраний з O, S і N кільцевий член в  
ортоположенні до місця з'єднання R<sup>4</sup> з піридино-  
вим кільцем.

(13) C2

(11) 89000

(19) UA

6. Застосування сполуки формули I і їх солей за одним з пп. 1-5 для боротьби з фітопатогенними грибами.

7. Засіб для захисту рослин, що містить твердий або рідкий носій і сполуку формули I і/або її сіль за одним з пп. 1-5.

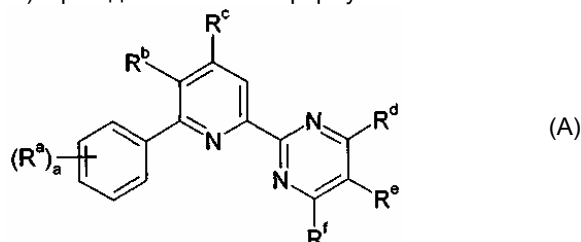
8. Посівний матеріал, що містить щонайменше одну сполуку формули I і/або її сіль за одним з пп. 1-5.

9. Спосіб боротьби з фітопатогенними грибами, який **відрізняється** тим, що гриби або матеріали, рослини, ґрунт або посівний матеріал, що підлягають захисту від ураження грибами, обробляють ефективною кількістю сполуки формули I або її сіллю за одним з пп. 1-5.

Даний винахід відноситься до 2-(піридин-2-іл)-піримідинів і їх застосування для боротьби зі шкідливими грибами, а також до засобів для захисту рослин, які містять подібні сполуки як діючий компонент.

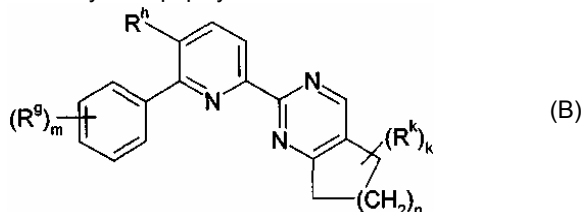
Документ EP-A 234 104 описує 2-(піридин-2-іл)-піримідини, які в 6-положенні піридинового залишку мають алкільну групу і які в 3,4-положенні піримідинового циклу можуть мати анельоване насичене 5- або 6- кільце. Сполуки придатні для боротьби з фітопатогенними грибами (шкідливі гриби).

Документ EP-A 259 139 описує 2-(піридин-2-іл)-піримідини загальної формули A



в якій а означає 0, 1, 2, 3, 4 або 5, R<sup>a</sup> означає галоген, низькомолекулярний алкіл, низькомолекулярний алкокси або галогеналкіл, R<sup>b</sup> і R<sup>c</sup> незалежно один від іншого означають водень або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, R<sup>d</sup> означає водень або низькомолекулярний алкіл, R<sup>e</sup> означає водень, низькомолекулярний алкіл або галоген або разом з R<sup>d</sup> означає пропан-1,3-діл або бутан-1,4-діл і R<sup>f</sup> в тому числі означає водень, алкіл, низькомолекулярний алкокси або низькомолекулярний алкілтіо.

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



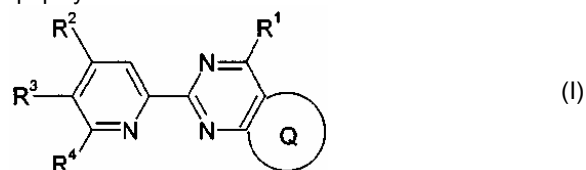
в якій: k означає 0, 1, 2 або 3, m означає 0, 1, 2, 3, 4 або 5 і n означає 1, 2, 3, 4 або 5, замісники R<sup>e</sup> в тому числі означають галоген, OH, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкініл, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, аміно, фенокси, тощо, R<sup>h</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, гідрокси, галоген, CN або NO<sub>2</sub> і R<sup>k</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл.

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

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

Несподівано задача вирішується за допомогою сполуки 2-(піридин-2-іл)-піримідину загальної формули I



в якій:

Q означає конденсований, насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл або 5-, 6- або 7-членний гетероцикл, який поряд з членами вуглецевого кільця як кільцеві члени має один або два гетероатоми, вибрані з кисню і сірки, причому карбоцикл і гетероцикл є незаміщеними або мають як замісники 1, 2, 3 або 4 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкільні групи;

R<sup>1</sup> означає водень, OH, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси або галоген;

R<sup>2</sup> означає водень, NO<sub>2</sub>, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси;

R<sup>3</sup> означає водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

R<sup>4</sup> феніл, 5-членний гетероарил, який як атоми циклу має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту або 1 гетероатом, вибраний з кисню і сірки і при необхідності 1, 2 або 3 атоми азоту, або 6-членний гетарил, який як кільцеві члени має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту, причому феніл, 5- і 6-членний гетарил можуть мати 1, 2, 3 або 4 замісники R<sup>a</sup>, причому

R<sup>a</sup> вибраний з OH, SH, галоген, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіламіно, ді(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл)аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкілсульфініл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкілсульфініл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкілсульфоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкілсульфоніл, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкіл, фе-

ніл, фенокси і залишків формули  $C(=Z)R^{aa}$ , в якій Z означає O, S,  $N(C_1-C_8\text{-алкіл})$ ,  $N(C_1-C_8\text{-алкокси})$ ,  $N(C_1-C_8\text{-алкенілокси})$  або  $N(C_3-C_8\text{-алкінілокси})$  означає і  $R^{aa}$  водень,  $C_1-C_4\text{-алкіл}$ ,  $C_1-C_4\text{-алкокси}$ ,  $NH_2$ ,  $C_1-C_8\text{-алкіламіно}$  або  $di(C_1-C_8\text{-алкіл})аміно$ ;

і застосовні в сільському господарстві солі сполук формули I;

за винятком сполук формули I, в якій  $R^2$  означає водень або  $C_1-C_8\text{-алкіл}$ ,  $R^4$  означає феніл, який при необхідності має 1, 2, 3 або 4 замісника  $R^a$  і Q означає конденсований, насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл, який є незаміщеним або як замісники має 1, 2, 3 або 4  $C_1-C_4\text{-алкільні}$  групи, і застосовні в сільському господарстві солі цієї сполуки.

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

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

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

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

Серед прийнятих в сільському господарстві солей, насамперед, придатні солі тих катіонів або кислотноадитивні солі тих кислот, катіони яких, відповідно аніони не послабляють фунгіцидну дію сполуки I. Таким чином, як катіони особливо придатні іони лужних металів, переважно натрію і калію, лужноземельних металів, переважно кальцію, магнію і барію, і перехідних металів, переважно марганцю, міді, цинку і заліза, а також іон амонію, який бажано може мати від одного до чотирьох  $C_1-C_4\text{-алкільних}$  замісника і/або один феніловий або бензиловий замісник, переважно дізопропіламоній, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, триметилбензиламоній, крім того, іони фосфонію, іони сульфонію, переважно три( $C_1-C_4\text{-алкіл}$ )сульфонію або іони сульфоксонію, переважно три( $C_1-C_4\text{-алкіл}$ )сульфоксонію.

Аніонами застосовних кислотноадитивних солей в першу чергу є хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідрофосфат, гідрофосфат, фосфат, нітрат, гідрокарбонат, карбонат, гексафторосилікат, гексафторфосфат, бензоат, а також аніони  $C_1-C_4\text{-алканових}$  кислот, переважно

форміат, ацетат, пропіонат і бутират. Вони можуть бути утворені за допомогою реакції сполуки формули I з кислотою відповідного аніону, переважно хлористоводневою кислотою, бромистоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою або азотною кислотою.

В зазначених значеннях змінних в наведених вище формулах використовуються збірні поняття, які загалом означають відповідні замісники. Значення  $C_n-C_m$  указує можливе кожний раз кількість атомів вуглецю у відповідному заміснику або частині замісника:

галоген: фтор, хлор, бром і йод;

алкіл, а також всі алкільні частини в алкокси, алкоксиалкіл, алкілкарбоніл, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфоніл, алкілсульфініл, алкіламіно, діалкіламіно, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл: насичені, з прямим ланцюгом або розгалужені вуглеводневі залишки з від 1 до 8 ( $C_1-C_8\text{-алкіл}$ ), часто від 1 до 6 ( $C_1-C_6\text{-алкіл}$ ) і особливо від 1 до 4 атомами вуглецю ( $C_1-C_4\text{-алкіл}$ ), такі як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-ді-метилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл і 1-етил-2-метилпропіл, гептил, 1-метилгексил, октил, 1-метилгептил і 2-етилгексил;

гало(ген)алкіл, а також всі галогеналкільні частини в галогеналкокси і галогеналкілтіо: з прямим ланцюгом або розгалужені алкільні групи з від 1 до 8 і особливо від 1 до 4 атомами вуглецю (як наведено вище), причому в цих групах частково або повністю атоми водню можуть бути заміщені атомами галогену як наведені вище і особливо фтором або хлором, особливо  $C_1-C_2\text{-галогеналкіл}$ , такий як хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-брометил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил і 1,1,1-трифторпроп-2-іл;

алкеніл: мононенасичені, з прямим ланцюгом або розгалужені вуглеводневі залишки з від 2 до 8 або 3 до 8 атомами вуглецю і подвійним зв'язком в будь-якому положенні, наприклад, етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл;

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

циклоалкіл: моноциклічні, насичені вуглеводневі групи з від 3 до 8, переважно до 6 вуглецеви-

ми кільцевими членами, такими як циклопропіл, циклобутил, циклопентил і циклогексил;

циклоалкілметил: циклоалкільний залишок, як наведено вище, який зв'язаний за допомогою метиленової групи ( $\text{CH}_2$ ).

Алкиламіно, а також алкіламіно частини в алкіламінокарбонілі: зв'язану за допомогою  $\text{NH}$ -групи алкільну групу, в якій алкіл означає один з зазначених вище алкільних залишків з від 1 до 8 С-атомами, такі як метиламіно, етиламіно, n-пропіламіно, ізопропіл аміно, n-бутиламіно і тому подібні;

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

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

алкоксикарбонілі: зв'язаний карбонільною групою алкокси залишок, як наведено вище;

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

алкілсульфініл: зв'язану за допомогою  $\text{S}(\text{=O})$ -групу алкільну групу як наведено вище;

алкілсульфоніл: зв'язану за допомогою  $\text{S}(\text{=O})_2$ -групи алкільну групу як наведено вище;

галогеналкокси: алкокси залишок з від 1 до 8, особливо від 1 до 6 і особливо від 1 до 4 С-атомами як наведено вище, який частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, переважно фтором, отже, наприклад,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{OCHCl}_2$ ,  $\text{OCCl}_3$ , хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 2-фторетокси, 2-хлоретокси, 2-брометокси, 2-йодетокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2-хлор-2-фторетокси, 2-хлор-2,2-дифторетокси, 2,2-дихлор-2-фторетокси, 2,2,2-трихлоретокси,  $\text{OC}_2\text{F}_5$ , 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 2-бромпропокси, 3-бромпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси,  $\text{OCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ ,  $\text{OCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ , 1-( $\text{CH}_2\text{F}$ )-2-фторетокси, 1-( $\text{CH}_2\text{Cl}$ )-2-хлоретокси, 1-( $\text{CH}_2\text{Br}$ )-2-брометокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси або нонафторбутокси;

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

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

олан, тіан, тіепан, 1,3-дитіолан, 1,3-дитіан і 1,4-дитіан;

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

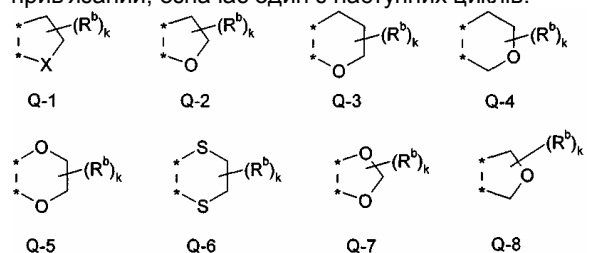
- 5-членний гетероарил, який як кільцеві члени має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту, такі як 1-, 2- або 3-піроліл, 1-, 3- або 4-піразоліл, 1-, 2- або 4-імідазоліл, 1,2,3-[1H]-тріазол-1-іл, 1,2,3-[2H]-тріазол-2-іл, 1,2,3-[1H]-тріазол-4-іл, 1,2,3-[1H]-тріазол-5-іл, 1,2,3-[2H]-тріазол-4-іл, 1,2,4-[1H]-тріазол-1-іл,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

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

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

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

Відповідно до винаходу  $\text{Q}$  разом з С-атомами 4- і 5-положення піримідинового циклу, до якого прив'язаний  $\text{Q}$ , означає насичений 5-, 6- або 7-членний карбоцикл або гетероцикл, такий як визначений вище і може мати одну або декілька  $\text{C}_{1-4}$ -алкільних груп як замісники. Особливо  $\text{Q}$  разом з С-атомами піримідинового циклу, до яких він прив'язаний, означає один з наступних циклів:



де

\* означає атоми піримідинового циклу;

k означає 0, 1, 2, 3 або 4;

$\text{R}^b$  означає  $\text{C}_{1-4}$ -алкіл, особливо метил; і

X означає  $(\text{CH}_2)_n$  з  $n=1, 2$  або 3.

Залишки  $\text{R}^b$  можуть бути розташовані у будь-яких атомів вуглецю цих циклів і, наприклад, якщо  $k \neq 0$ , то 1, 2, 3 або 4 атоми водню в  $(\text{CH}_2)_n$  можуть бути заміщені за допомогою  $\text{R}^b$ . Орієнтація залишків  $\text{Q}-2$ ,  $\text{Q}-3$  і  $\text{Q}-4$  відносно піримідинового циклу є довільною. Серед залишків від  $\text{Q}-1$  до  $\text{Q}-8$  особливо переважним є залишок  $\text{Q}-1$  і  $\text{Q}-3$  і особливо

залишки Q-1 з  $n=2$  або 3. Змінна  $k$  особливо означає 0, 1 або 2.

$R^1$  переважно вибраний з водню, фтору, хлору, метилу, етилу, метокси, етоксиди,  $CF_3$ ,  $CHF_2$ ,  $OCF_3$  і  $OCHF_2$ . Особливо переважно  $R^1$  означає водень.

$R^2$  переважно вибраний з водню, фтору, хлору,  $C_1$ - $C_4$ -алкілу, особливо метилу, етилу, ізопропілу або грег.-бутилу, метокси,  $CF_3$ ,  $CHF_2$ ,  $OCF_3$  і  $OCHF_2$ . Особливо переважними є сполуки формули I, в якій  $R^2$  означає водень. Рівним чином особливо переважними є сполуки формули I, в якій  $R^2$  означає метил. Рівним чином особливо переважними є сполуки формули I, в якій  $R^2$  означає метокси.

Рівним чином особливо переважними є сполуки формули I, в якій  $R^2$  означає хлор.

$R^3$  переважно означає залишок, що відрізняється від водню. Особливо переважними є наведені нижче сполуки формули I, в яких  $R^3$  означає фтор, хлор,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, особливо метил, або метокси. Зовсім особливо переважно  $R^3$  означає метил, фтор або метокси.

Беручи до уваги їх фунгіцидну дію переважними є сполуки загальної формули I, в якій  $R^4$  означає один з наступних залишків:

- 5-членний гетероарил, який поряд з вуглецем як атоми циклу має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту;

- 5-членний гетероарил, який поряд з вуглецем як атоми циклу має 1 гетероатом, вибраний з кисню і сірки і при необхідності 1, 2 або 3 атоми азоту, особливо тієніл або фурил;

- 6-членний гетарил, який як атоми циклу має 1, 2, 3 або 4 атоми азоту, особливо піридил або піримідиніл;

причому 5- і 6-членний гетарил може бути незаміщеним або атоми водню в незаміщеному гетарилі частково або повністю можуть бути замінені замісником  $R^a$  зазначеного вище виду, так що загальне число всіх замісників  $R^a$  в гетарилі типово становить 1, 2, 3 або 4. Замісниками кільцевих атомів азоту особливо є C-зв'язані залишки  $R^a$  і особливо  $C_1$ - $C_4$ -алкіл.

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

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

Серед гетероароматичних залишків  $R^4$  особливо переважними є ті залишки, які мають, щонайменше, один замісник і/або, щонайменше, один кільцевий член, вибраний з O, S і N, в орто-

положенні до місця сполучення  $R^4$  з піридиновим циклом.

Прикладами переважних гетероароматичних залишків  $R^4$  є

- при необхідності заміщений 2-тієніл, такий як незаміщений 2-тієніл, 5-метилтієніл-2-іл, 4-метилтієніл-2-іл, 5-хлортієніл-2-іл, 3-ціанотієніл-2-іл, 4-бромтієніл-2-іл, 3,5-дихлортієніл-2-іл, 3,4,5-трихлортієніл-2-іл, 5-бромтієніл-2-іл,

- при необхідності заміщений 3-тієніл, такий як незаміщений 3-тієніл, 2-метилтієніл-3-іл, 2,5-дихлортієніл-3-іл,

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

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

- при необхідності заміщений 2-піридил, такий як незаміщений 2-піридил, 3-фтор-піридин-2-іл, 3-хлор-піридин-2-іл, 3-бромпіридин-2-іл, 3-трифторметил-піридин-2-іл, 3-метил-піридин-2-іл, 3-етил-піридин-2-іл, 3,5-дифтор-піридин-2-іл, 3,5-дихлор-піридин-2-іл, 3,5-дибром-піридин-2-іл, 3,5-диметил-піридин-2-іл, 3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл, 3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл, 3-хлор-5-метил-піридин-2-іл, 3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл, 3-фтор-5-метил-піридин-2-іл, 3-метил-5-фтор-піридин-2-іл, 3-метил-5-хлор-піридин-2-іл, 5-нітро-піридин-2-іл, 5-ціано-піридин-2-іл, 5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл, 5-трифторметил-піридин-2-іл, 5-метил-піридин-2-іл, 4-метил-піридин-2-іл, 6-метил-піридин-2-іл,

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

- при необхідності заміщений 4-піридил, такий як незаміщений 4-піридил, 3-хлор-піридин-4-іл, 3-бром-піридин-4-іл, 3-метил-піридин-4-іл, 3,5-дихлор-піридин-4-іл, 3,5-дибром-піридин-4-іл, 3,5-диметил-піридин-4-іл, при необхідності заміщений 4-піримідиніл, такий як незаміщений 4-піримідиніл, 5-хлорпіримідин-4-іл, 5-фторпіримідин-4-іл, 5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл, 2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл, 6-трифторметил-піримідин-4-іл, 2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл, 2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл, 5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл, 5-бром-6-метил-піримідин-4-іл, 5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл, 5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл, 2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл, 5,6-диметил-піримідин-4-іл,

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

Відповідно до іншої форми здійснення  $R^4$  означає при необхідності заміщений феніл. Оскільки  $R^4$  при необхідності означає заміщений феніл, то в випадку Q мова переважно йде про 5-, 6- або 7-членний гетероцикл, такий як визначений вище і може мати одну або декілька  $C_1$ - $C_4$ -алкільних груп як замісники. В такому випадку особливо Q означає один з залишків Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7 або Q-8 і особливо один з залишків Q-2, Q-3 або Q-4.

Оскільки  $R^4$  означає феніл, який при необхідності заміщений 1, 2, 3 або 4 залишками  $R^a$ , і  $R^2$  відрізняється від водню і  $C_1$ - $C_6$ -алкілу, тоді Q також може означати один 5-, 6- або 7-членний карбоцикл, такий як визначений вище і може мати одну або декілька  $C_1$ - $C_4$ -алкільних груп як замісники. В цьому випадку Q переважно означає залишок Q-1 з  $n=2$  або 3. Змінна k особливо означає 0, 1 або 2.  $R^2$  тоді особливо 0438 означає фтор, хлор, метокси,  $CF_3$ ,  $CHF_2$ ,  $OCF_3$  або  $OCHF_2$ , особливо метокси або хлор.

В цій формі здійснення  $R^4$  переважно означає залишок формули P:



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

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

$R^{12}$ ,  $R^{14}$  незалежно один від іншого водень, хлор, фтор,  $CH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $OCHF_2$ ,

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

$R^{13}$  водень, фтор, хлор, ціано, OH, CHO,  $NO_2$ ,  $NH_2$ , метиламіно, диметиламіно, діетиламіно,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, особливо  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ ,  $CH(CH_3)_2$ ,  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл, особливо циклопропіл, циклопентил або циклогексил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси, особливо  $OCH_3$ ,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтіо, особливо метилтіо або етилтіо,  $C_1$ - $C_4$ -галоалкіл, особливо  $CF_3$ ,  $C_1$ - $C_4$ -галоалкокси,

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

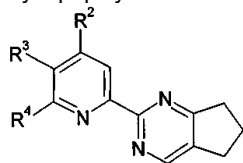
$R^{15}$  водень, фтор, хлор, або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, особливо  $CH_3$ , особливо водень або фтор.

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

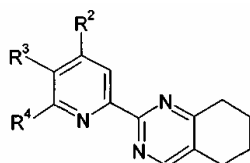
Прикладами залишків P є наведені в подальшому залишки: феніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-трифторметилфеніл, 3-трифторметилфеніл, 4-трифторметилфеніл, 2-(метилтіо)феніл, 3-(метилтіо)феніл, 4-(метилтіо)феніл, 2-метоксифеніл,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

2-фторфеніл, 4-метоксикарбоніл-2-фторфеніл, 4-етоксикарбоніл-2-фторфеніл, 4-трет.-бутоксикарбоніл-2-фторфеніл.

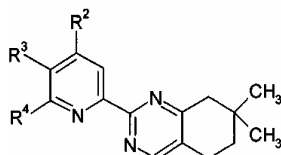
Особливо переважними є наступні групи сполук формули I:



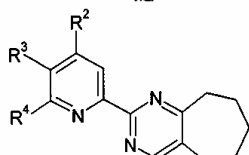
I.1



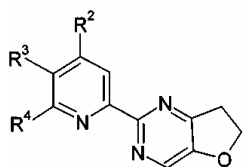
I.2



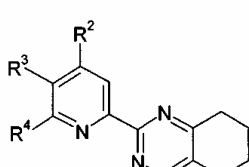
I.3



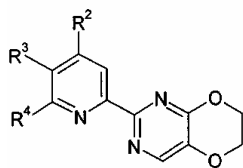
I.4



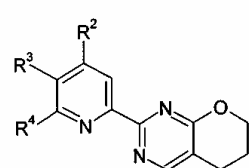
I.5



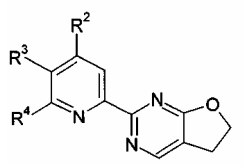
I.6



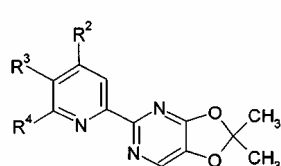
I.7



I.8



I.9



I.10

Особливо, враховуючи їх застосування, переважними є сполуки I, представлені в нижченаведених таблицях з 1 по 16.

Таблиця 1

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає водень і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків від A-331 до A-638 таблиці A.

Таблиця 2

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає метил і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків від A-331 до A-638 таблиці A.

Таблиця 3

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає ізопропіл (CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>) і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup>

кожного разу відповідає сполуці одного з рядків від A-331 до A-638 таблиці A.

Таблиця 4

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає трет.-бутил (C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>) і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків від A-331 до A-638 таблиці A.

Таблиця 5

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає метокси і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 6

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає фтор і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 7

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає хлор і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 8

Сполуки формул I.1, I.2, I.3 і I.4, в яких R<sup>2</sup> означає трифторметил і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 9

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає водень і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 10

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає метил і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 11

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає ізопропіл (CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>) і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 12

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає трет.-бутил (C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>) і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 13

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає метокси і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 14

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає фтор, і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 15

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає хлор, і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця 16

Сполуки формул I.5, I.6, I.7, I.8, I.9 і I.10, в яких R<sup>2</sup> означає трифторметил і комбінація з R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> кожного разу відповідає сполуці одного з рядків таблиці A.

Таблиця А

№	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-1	CH <sub>3</sub>	феніл
A-2	CH <sub>3</sub>	2-фторфеніл
A-3	CH <sub>3</sub>	3-фторфеніл
A-4	CH <sub>3</sub>	4-фторфеніл
A-5	CH <sub>3</sub>	2-хлорфеніл
A-6	CH <sub>3</sub>	3-хлорфеніл
A-7	CH <sub>3</sub>	4-хлорфеніл
A-8	CH <sub>3</sub>	2-трифторметилфеніл
A-9	CH <sub>3</sub>	3-трифторметилфеніл
A-10	CH <sub>3</sub>	4-трифторметилфеніл
A-11	CH <sub>3</sub>	2-(метилтіо)феніл
A-12	CH <sub>3</sub>	3-(метилтіо)феніл
A-13	CH <sub>3</sub>	4-(метилтіо)феніл
A-14	CH <sub>3</sub>	2-метоксифеніл
A-15	CH <sub>3</sub>	3-метоксифеніл
A-16	CH <sub>3</sub>	4-метоксифеніл
A-17	CH <sub>3</sub>	3-нітрофеніл
A-18	CH <sub>3</sub>	4-нітрофеніл
A-19	CH <sub>3</sub>	4-ціанофеніл
A-20	CH <sub>3</sub>	4-амінокарбонілфеніл
A-21	CH <sub>3</sub>	4-формілфеніл
A-22	CH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутилфеніл
A-23	CH <sub>3</sub>	4-ізопропіл феніл
A-24	CH <sub>3</sub>	4-етоксифеніл
A-25	CH <sub>3</sub>	4-п-пропоксифеніл
A-26	CH <sub>3</sub>	4-ізопропоксифеніл
A-27	CH <sub>3</sub>	4-п-бутоксифеніл
A-28	CH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксифеніл
A-29	CH <sub>3</sub>	4-ацетилфеніл
A-30	CH <sub>3</sub>	4-метоксикарбонілфеніл
A-31	CH <sub>3</sub>	4-етоксикарбонілфеніл
A-32	CH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбонілфеніл
A-33	CH <sub>3</sub>	4-(метоксиімінометил)феніл
A-34	CH <sub>3</sub>	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-35	CH <sub>3</sub>	3-ізопропоксифеніл
A-36	CH <sub>3</sub>	3-етоксифеніл
A-37	CH <sub>3</sub>	3-бромфеніл
A-38	CH <sub>3</sub>	4-бромфеніл
A-39	CH <sub>3</sub>	3,4-диметоксифеніл
A-40	CH <sub>3</sub>	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-41	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-ізопропілфеніл
A-42	CH <sub>3</sub>	2,3,5-трифторфеніл
A-43	CH <sub>3</sub>	2,4,5-трифторфеніл
A-44	CH <sub>3</sub>	2,3,4-трифторфеніл



A-45	CH <sub>3</sub>	2,4,5-триметилфеніл
A-46	CH <sub>3</sub>	2-фтор-3-метоксифеніл
A-47	CH <sub>3</sub>	2-фтор-6-метоксифеніл
A-48	CH <sub>3</sub>	5-хлор-2-метилфеніл
A-49	CH <sub>3</sub>	3-хлор-2-метилфеніл
A-50	CH <sub>3</sub>	2-фтор-5-хлорфеніл
A-51	CH <sub>3</sub>	6-фтор-2-хлорфеніл
A-52	CH <sub>3</sub>	2-хлор-3-метоксифеніл
A-53	CH <sub>3</sub>	2-хлор-6-метоксифеніл
A-54	CH <sub>3</sub>	2-метил-6-метоксифеніл
A-55	CH <sub>3</sub>	2,3-дифторфеніл
A-56	CH <sub>3</sub>	2,4-дифторфеніл
A-57	CH <sub>3</sub>	2,5-дифторфеніл
A-58	CH <sub>3</sub>	3,4-дифторфеніл
A-59	CH <sub>3</sub>	3,5-дифторфеніл
A-60	CH <sub>3</sub>	2,6-дифторфеніл
A-61	CH <sub>3</sub>	2,4,6-трифторфеніл
A-62	CH <sub>3</sub>	3,4,5-трифторфеніл
A-63	CH <sub>3</sub>	2,3-дихлорфеніл
A-64	CH <sub>3</sub>	2,5-дихлорфеніл
A-65	CH <sub>3</sub>	3,5-дихлорфеніл
A-66	CH <sub>3</sub>	2,6-дихлорфеніл
A-67	CH <sub>3</sub>	2,3-диметилфеніл
A-68	CH <sub>3</sub>	2,4-диметилфеніл
A-69	CH <sub>3</sub>	2,5-диметилфеніл
A-70	CH <sub>3</sub>	2,3-диметоксифеніл
A-71	CH <sub>3</sub>	2,4-диметоксифеніл
A-72	CH <sub>3</sub>	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-73	CH <sub>3</sub>	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-74	CH <sub>3</sub>	2-метил-3-метоксифеніл
A-75	CH <sub>3</sub>	2-метил-4-метоксифеніл
A-76	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-фторфеніл
A-77	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-фторфеніл
A-78	CH <sub>3</sub>	4-хлор-2-фторфеніл
A-79	CH <sub>3</sub>	4-фтор-3-метилфеніл
A-80	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-метилфеніл
A-81	CH <sub>3</sub>	4-фтор-2-метилфеніл
A-82	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-метоксифеніл
A-83	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-84	CH <sub>3</sub>	4-хлор-3-метилфеніл
A-85	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метилфеніл
A-86	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метоксифеніл
A-87	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-88	CH <sub>3</sub>	3-фтор-4-метилфеніл
A-89	CH <sub>3</sub>	4-фтор-3-метилфеніл
A-90	CH <sub>3</sub>	3-фтор-4-метоксифеніл
A-91	CH <sub>3</sub>	3-фтор-4-етоксифеніл
A-92	CH <sub>3</sub>	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-93	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-метилфеніл

A-94	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-метоксифеніл
A-95	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-етоксифеніл
A-96	CH <sub>3</sub>	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-97	CH <sub>3</sub>	3-метил-4-метокси
A-98	CH <sub>3</sub>	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-99	CH <sub>3</sub>	2,6-дифтор-4-трифторметилфеніл
A-100	CH <sub>3</sub>	2,6-дихлор-4-трифторметилфеніл
A-101	CH <sub>3</sub>	4-ціано-2-фторфеніл
A-102	CH <sub>3</sub>	4-амінокарбоніл-2-фторфеніл
A-103	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-формілфеніл
A-104	CH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутил-2-фторфеніл
A-105	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-106	CH <sub>3</sub>	4-етокси-2-фторфеніл
A-107	CH <sub>3</sub>	4-ацетил-2-фторфеніл
A-108	CH <sub>3</sub>	4-метоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-109	CH <sub>3</sub>	4-етоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-110	CH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-111	F	феніл
A-112	F	2-фторфеніл
A-113	F	3-фторфеніл
A-114	F	4-фторфеніл
A-115	F	2-хлорфеніл
A-116	F	3-хлорфеніл
A-117	F	4-хлорфеніл
A-118	F	2-трифторметилфеніл
A-119	F	3-трифторметилфеніл
A-120	F	4-трифторметилфеніл
A-121	F	2-(метилтіо)феніл
A-122	F	3-(метилтіо)феніл
A-123	F	4-(метилтіо)феніл
A-124	F	2-метоксифеніл
A-125	F	3-метоксифеніл
A-126	F	4-метоксифеніл
A-127	F	3-нітрофеніл
A-128	F	4-нітрофеніл
A-129	F	4-ціанофеніл
A-130	F	4-амінокарбонілфеніл
A-131	F	4-формілфеніл
A-132	F	4- <i>трет.</i> -бутилфеніл
A-133	F	4-ізопропіл феніл
A-134	F	4-етоксифеніл
A-135	F	4-п-пропоксифеніл
A-136	F	4-ізопропоксифеніл
A-137	F	4-п-бутоксифеніл
A-138	F	4- <i>трет.</i> -бутоксифеніл
A-139	F	4-ацетилфеніл
A-140	F	4-метоксикарбонілфеніл
A-141	F	4-етоксикарбонілфеніл
A-142	F	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбонілфеніл
A-143	F	4-(метоксиімінометил)феніл

A-144	F	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-145	F	3-ізопропоксифеніл
A-146	F	3-етоксифеніл
A-147	F	3-бромфеніл
A-148	F	4-бромфеніл
A-149	F	3,4-диметоксифеніл
A-150	F	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-151	F	3-хлор-4-ізопропілфеніл
A-152	F	2,3,5-трифторфеніл
A-153	F	2,4,5-трифторфеніл
A-154	F	2,3,4-трифторфеніл
A-155	F	2,4,5-триметилфеніл
A-156	F	2-фтор-3-метоксифеніл
A-157	F	2-фтор-6-метоксифеніл
A-158	F	5-хлор-2-метилфеніл
A-159	F	3-хлор-2-метилфеніл
A-160	F	2-фтор-5-хлорфеніл
A-161	F	6-фтор-2-хлорфеніл
A-162	F	2-хлор-3-метоксифеніл
A-163	F	2-хлор-6-метоксифеніл
A-164	F	2-метил-6-метоксифеніл
A-165	F	2,3-дифторфеніл
A-166	F	2,4-дифторфеніл
A-167	F	2,5-дифторфеніл
A-168	F	3,4-дифторфеніл
A-169	F	3,5-дифторфеніл
A-170	F	2,6-дифторфеніл
A-171	F	2,4,6-трифторфеніл
A-172	F	3,4,5-трифторфеніл
A-173	F	2,3-дихлорфеніл
A-174	F	2,5-дихлорфеніл
A-175	F	3,5-дихлорфеніл
A-176	F	2,6-дихлорфеніл
A-177	F	2,3-диметилфеніл
A-178	F	2,4-диметилфеніл
A-179	F	2,5-диметилфеніл
A-180	F	2,3-диметоксифеніл
A-181	F	2,4-диметоксифеніл
A-182	F	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-183	F	3,5-біс(трифторметил)феніл
A-184	F	2-метил-3-метоксифеніл
A-185	F	2-метил-4-метоксифеніл
A-186	F	3-хлор-4-фторфеніл
A-187	F	2-хлор-4-фторфеніл
A-188	F	4-хлор-2-фторфеніл
A-189	F	4-фтор-3-метилфеніл
A-190	F	2-фтор-4-метилфеніл
A-191	F	4-фтор-2-метилфеніл
A-192	F	2-фтор-4-метоксифеніл

A-193	F	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-194	F	4-хлор-3-метилфеніл
A-195	F	2-хлор-4-метилфеніл
A-196	F	2-хлор-4-метоксифеніл
A-197	F	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-198	F	3-фтор-4-метилфеніл
A-199	F	4-фтор-3-метилфеніл
A-200	F	3-фтор-4-метоксифеніл
A-201	F	3-фтор-4-етоксифеніл
A-202	F	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-203	F	3-хлор-4-метилфеніл
A-204	F	3-хлор-4-метоксифеніл
A-205	F	3-хлор-4-етоксифеніл
A-206	F	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-207	F	3-метил-4-метокси
A-208	F	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-209	F	2,6-дифтор-4-трифторметилфеніл
A-210	F	2,6-дихлор-4-трифторметилфеніл
A-211	F	4-ціано-2-фторфеніл
A-212	F	4-амінокарбоніл-2-фторфеніл
A-213	F	2-фтор-4-формілфеніл
A-214	F	4- <i>трет.</i> -бутил-2-фторфеніл
A-215	F	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-216	F	4-етокси-2-фторфеніл
A-217	F	4-ацетил-2-фторфеніл
A-218	F	4-метоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-219	F	4-етоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-220	F	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-221	OCH <sub>3</sub>	феніл
A-222	OCH <sub>3</sub>	2-фторфеніл
A-223	OCH <sub>3</sub>	3-фторфеніл
A-224	OCH <sub>3</sub>	4-фторфеніл
A-225	OCH <sub>3</sub>	2-хлорфеніл
A-226	OCH <sub>3</sub>	3-хлорфеніл
A-227	OCH <sub>3</sub>	4-хлорфеніл
A-228	OCH <sub>3</sub>	2-трифторметилфеніл
A-229	OCH <sub>3</sub>	3-трифторметилфеніл
A-230	OCH <sub>3</sub>	4-трифторметилфеніл
A-231	OCH <sub>3</sub>	2-(метилтіо)феніл
A-232	OCH <sub>3</sub>	3-(метилтіо)феніл
A-233	OCH <sub>3</sub>	4-(метилтіо)феніл
A-234	OCH <sub>3</sub>	2-метоксифеніл
A-235	OCH <sub>3</sub>	3-метоксифеніл
A-236	OCH <sub>3</sub>	4-метоксифеніл
A-237	OCH <sub>3</sub>	3-нітрофеніл
A-238	OCH <sub>3</sub>	4-нітрофеніл
A-239	OCH <sub>3</sub>	4-ціанофеніл
A-240	OCH <sub>3</sub>	4-амінокарбонілфеніл
A-241	OCH <sub>3</sub>	4-формілфеніл
A-242	OCH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутилфеніл
A-243	OCH <sub>3</sub>	4-ізопропіл феніл

A-244	OCH <sub>3</sub>	4-етоксифеніл
A-245	OCH <sub>3</sub>	4-п-пропоксифеніл
A-246	OCH <sub>3</sub>	4-ізопропоксифеніл
A-247	OCH <sub>3</sub>	4-п-бутоксифеніл
A-248	OCH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксифеніл
A-249	OCH <sub>3</sub>	4-ацетилфеніл
A-250	OCH <sub>3</sub>	4-метоксикарбонілфеніл
A-251	OCH <sub>3</sub>	4-етоксикарбонілфеніл
A-252	OCH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбонілфеніл
A-253	OCH <sub>3</sub>	4-(метоксиімінометил)феніл
A-254	OCH <sub>3</sub>	4-(1-(метоксиіміно)етил)феніл
A-255	OCH <sub>3</sub>	3-ізопропоксифеніл
A-256	OCH <sub>3</sub>	3-етоксифеніл
A-257	OCH <sub>3</sub>	3-бромфеніл
A-258	OCH <sub>3</sub>	4-бромфеніл
A-259	OCH <sub>3</sub>	3,4-диметоксифеніл
A-260	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-4-ізопропілфеніл
A-261	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-ізопропілфеніл
A-262	OCH <sub>3</sub>	2,3,5-трифторфеніл
A-263	OCH <sub>3</sub>	2,4,5-трифторфеніл
A-264	OCH <sub>3</sub>	2,3,4-трифторфеніл
A-265	OCH <sub>3</sub>	2,4,5-триметилфеніл
A-266	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-3-метоксифеніл
A-267	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-6-метоксифеніл
A-268	OCH <sub>3</sub>	5-хлор-2-метилфеніл
A-269	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-2-метилфеніл
A-270	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-5-хлорфеніл
A-271	OCH <sub>3</sub>	6-фтор-2-хлорфеніл
A-272	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-3-метоксифеніл
A-273	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-6-метоксифеніл
A-274	OCH <sub>3</sub>	2-метил-6-метоксифеніл
A-275	OCH <sub>3</sub>	2,3-дифторфеніл
A-276	OCH <sub>3</sub>	2,4-дифторфеніл
A-277	OCH <sub>3</sub>	2,5-дифторфеніл
A-278	OCH <sub>3</sub>	3,4-дифторфеніл
A-279	OCH <sub>3</sub>	3,5-дифторфеніл
A-280	OCH <sub>3</sub>	2,6-дифторфеніл
A-281	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-трифторфеніл
A-282	OCH <sub>3</sub>	3,4,5-трифторфеніл
A-283	OCH <sub>3</sub>	2,3-дихлорфеніл
A-284	OCH <sub>3</sub>	2,5-дихлорфеніл
A-285	OCH <sub>3</sub>	3,5-дихлорфеніл
A-286	OCH <sub>3</sub>	2,6-дихлорфеніл
A-287	OCH <sub>3</sub>	2,3-диметилфеніл
A-288	OCH <sub>3</sub>	2,4-диметилфеніл
A-289	OCH <sub>3</sub>	2,5-диметилфеніл
A-290	OCH <sub>3</sub>	2,3-диметоксифеніл
A-291	OCH <sub>3</sub>	2,4-диметоксифеніл
A-292	OCH <sub>3</sub>	2,4-біс(трифторметил)феніл
A-293	OCH <sub>3</sub>	3,5-біс(трифторметил)феніл

A-294	OCH <sub>3</sub>	2-метил-3-метоксифеніл
A-295	OCH <sub>3</sub>	2-метил-4-метоксифеніл
A-296	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-фторфеніл
A-297	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-фторфеніл
A-298	OCH <sub>3</sub>	4-хлор-2-фторфеніл
A-299	OCH <sub>3</sub>	4-фтор-3-метилфеніл
A-300	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-метилфеніл
A-301	OCH <sub>3</sub>	4-фтор-2-метилфеніл
A-302	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-метоксифеніл
A-303	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-трифторметилфеніл
A-304	OCH <sub>3</sub>	4-хлор-3-метилфеніл
A-305	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метилфеніл
A-306	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метоксифеніл
A-307	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-трифторметилфеніл
A-308	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-4-метилфеніл
A-309	OCH <sub>3</sub>	4-фтор-3-метилфеніл
A-310	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-4-метоксифеніл
A-311	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-4-етоксифеніл
A-312	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-4-трифторметилфеніл
A-313	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-метилфеніл
A-314	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-метоксифеніл
A-315	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-етоксифеніл
A-316	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-4-трифторметилфеніл
A-317	OCH <sub>3</sub>	3-метил-4-метокси
A-318	OCH <sub>3</sub>	4-хлор-2,5-дифторфеніл
A-319	OCH <sub>3</sub>	2,6-дифтор-4-трифторметилфеніл
A-320	OCH <sub>3</sub>	2,6-дихлор-4-трифторметилфеніл
A-321	OCH <sub>3</sub>	4-ціано-2-фторфеніл
A-322	OCH <sub>3</sub>	4-амінокарбоніл-2-фторфеніл
A-323	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-формілфеніл
A-324	OCH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутил-2-фторфеніл
A-325	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-ізопропілфеніл
A-326	OCH <sub>3</sub>	4-етокси-2-фторфеніл
A-327	OCH <sub>3</sub>	4-ацетил-2-фторфеніл
A-328	OCH <sub>3</sub>	4-метоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-329	OCH <sub>3</sub>	4-етоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-330	OCH <sub>3</sub>	4- <i>трет.</i> -бутоксикарбоніл-2-фторфеніл
A-331	CH <sub>3</sub>	5-метилтіофен-2-іл
A-332	CH <sub>3</sub>	4-метилтіофен-2-іл
A-333	CH <sub>3</sub>	5-хлортіофен-2-іл
A-334	CH <sub>3</sub>	3-ціанотіофен-2-іл
A-335	CH <sub>3</sub>	4-бромтіофен-2-іл
A-336	CH <sub>3</sub>	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-337	CH <sub>3</sub>	3,4,5-трихлортіофен-2-іл
A-338	CH <sub>3</sub>	5-бромтіофен-2-іл
A-339	CH <sub>3</sub>	3-тієніл
A-340	CH <sub>3</sub>	2-метилтіофен-3-іл

A-341	CH <sub>3</sub>	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-342	CH <sub>3</sub>	2-фурил
A-343	CH <sub>3</sub>	5-метилфуран-2-іл
A-344	CH <sub>3</sub>	5-хлорфуран-2-іл
A-345	CH <sub>3</sub>	4-метилфуран-2-іл
A-346	CH <sub>3</sub>	3-ціанофуран-2-іл
A-347	CH <sub>3</sub>	5-ацетилфуран-2-іл
A-348	CH <sub>3</sub>	3,5-дихлорфуран-2-іл
A-349	CH <sub>3</sub>	5-бромфуран-2-іл
A-350	CH <sub>3</sub>	3-фурил
A-351	CH <sub>3</sub>	2-метилфуран-3-іл
A-352	CH <sub>3</sub>	2,5-диметилфуран-3-іл
A-353	CH <sub>3</sub>	2-піридил
A-354	CH <sub>3</sub>	3-фтор-піридин-2-іл
A-355	CH <sub>3</sub>	3-хлор-піридин-2-іл
A-356	CH <sub>3</sub>	3-бром-2-піридин-2-іл
A-357	CH <sub>3</sub>	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-358	CH <sub>3</sub>	3-метил-піридин-2-іл
A-359	CH <sub>3</sub>	3-етил-піридин-2-іл
A-360	CH <sub>3</sub>	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-361	CH <sub>3</sub>	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-362	CH <sub>3</sub>	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-363	CH <sub>3</sub>	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-364	CH <sub>3</sub>	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-365	CH <sub>3</sub>	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-366	CH <sub>3</sub>	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-367	CH <sub>3</sub>	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-368	CH <sub>3</sub>	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-369	CH <sub>3</sub>	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-370	CH <sub>3</sub>	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-371	CH <sub>3</sub>	5-нітро-піридин-2-іл
A-372	CH <sub>3</sub>	5-ціано-піридин-2-іл
A-373	CH <sub>3</sub>	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-374	CH <sub>3</sub>	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-375	CH <sub>3</sub>	5-метил-піридин-2-іл
A-376	CH <sub>3</sub>	4-метил-піридин-2-іл
A-377	CH <sub>3</sub>	6-метил-піридин-2-іл
A-378	CH <sub>3</sub>	3-піридил
A-379	CH <sub>3</sub>	2-хлор-піридин-3-іл
A-380	CH <sub>3</sub>	2-бром-піридин-3-іл
A-381	CH <sub>3</sub>	2-метил-піридин-3-іл
A-382	CH <sub>3</sub>	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-383	CH <sub>3</sub>	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-384	CH <sub>3</sub>	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-385	CH <sub>3</sub>	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-386	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-387	CH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-388	CH <sub>3</sub>	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-389	CH <sub>3</sub>	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-390	CH <sub>3</sub>	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-391	CH <sub>3</sub>	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл



A-392	CH <sub>3</sub>	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-393	CH <sub>3</sub>	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-394	CH <sub>3</sub>	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-395	CH <sub>3</sub>	4-піридил
A-396	CH <sub>3</sub>	3-хлор-піридин-4-іл
A-397	CH <sub>3</sub>	3-бром-піридин-4-іл
A-398	CH <sub>3</sub>	3-метил-піридин-4-іл
A-399	CH <sub>3</sub>	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-400	CH <sub>3</sub>	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-401	CH <sub>3</sub>	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-402	CH <sub>3</sub>	4-піримідиніл
A-403	CH <sub>3</sub>	5-хлорпіримідин-4-іл
A-404	CH <sub>3</sub>	5-фторпіримідин-4-іл
A-405	CH <sub>3</sub>	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-406	CH <sub>3</sub>	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-407	CH <sub>3</sub>	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-408	CH <sub>3</sub>	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-409	CH <sub>3</sub>	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-410	CH <sub>3</sub>	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-411	CH <sub>3</sub>	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-412	CH <sub>3</sub>	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-413	CH <sub>3</sub>	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-414	CH <sub>3</sub>	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-415	CH <sub>3</sub>	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-416	CH <sub>3</sub>	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-417	CH <sub>3</sub>	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-418	CH <sub>3</sub>	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-419	CH <sub>3</sub>	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-420	CH <sub>3</sub>	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-421	CH <sub>3</sub>	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-422	CH <sub>3</sub>	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-423	CH <sub>3</sub>	5-піримідиніл
A-424	CH <sub>3</sub>	4-метил-піримідин-5-іл
A-425	CH <sub>3</sub>	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-426	CH <sub>3</sub>	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-427	CH <sub>3</sub>	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-428	CH <sub>3</sub>	2-піримідиніл
A-429	CH <sub>3</sub>	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-430	CH <sub>3</sub>	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-431	CH <sub>3</sub>	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-432	CH <sub>3</sub>	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-433	OCH <sub>3</sub>	2-тієніл
A-434	OCH <sub>3</sub>	5-метилтіофен-2-іл
A-435	OCH <sub>3</sub>	4-метилтіофен-2-іл
A-436	OCH <sub>3</sub>	5-хлортіофен-2-іл
A-437	OCH <sub>3</sub>	3-ціанотіофен-2-іл
A-438	OCH <sub>3</sub>	4-бромтіофен-2-іл
A-439	OCH <sub>3</sub>	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-440	OCH <sub>3</sub>	3,4,5-трихлортіофен-2-іл
A-441	OCH <sub>3</sub>	5-бромтіофен-2-іл



A-442	OCH <sub>3</sub>	3-тієніл
A-443	OCH <sub>3</sub>	2-метилтіофен-3-іл
A-444	OCH <sub>3</sub>	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-445	OCH <sub>3</sub>	2-фурил
A-446	OCH <sub>3</sub>	5-метилфуран-2-іл
A-447	OCH <sub>3</sub>	5-хлорфуран-2-іл
A-448	OCH <sub>3</sub>	4-метилфуран-2-іл
A-449	OCH <sub>3</sub>	3-ціанофуран-2-іл
A-450	OCH <sub>3</sub>	5-ацетилфуран-2-іл
A-451	OCH <sub>3</sub>	3,5-дихлорфуран-2-іл
A-452	OCH <sub>3</sub>	5-бромфуран-2-іл
A-453	OCH <sub>3</sub>	3-фурил
A-454	OCH <sub>3</sub>	2-метилфуран-3-іл
A-455	OCH <sub>3</sub>	2,5-диметилфуран-3-іл
A-456	OCH <sub>3</sub>	2-піридил
A-457	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-піридин-2-іл
A-458	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-піридин-2-іл
A-459	OCH <sub>3</sub>	3-бром-2-піридин-2-іл
A-460	OCH <sub>3</sub>	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-461	OCH <sub>3</sub>	3-метил-піридин-2-іл
A-462	OCH <sub>3</sub>	3-етил-піридин-2-іл
A-463	OCH <sub>3</sub>	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-464	OCH <sub>3</sub>	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-465	OCH <sub>3</sub>	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-466	OCH <sub>3</sub>	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-467	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-468	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-469	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-470	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-471	OCH <sub>3</sub>	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-472	OCH <sub>3</sub>	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-473	OCH <sub>3</sub>	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-474	OCH <sub>3</sub>	5-нітро-піридин-2-іл
A-475	OCH <sub>3</sub>	5-ціано-піридин-2-іл
A-476	OCH <sub>3</sub>	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-477	OCH <sub>3</sub>	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-478	OCH <sub>3</sub>	5-метил-піридин-2-іл
A-479	OCH <sub>3</sub>	4-метил-піридин-2-іл
A-480	OCH <sub>3</sub>	6-метил-піридин-2-іл
A-481	OCH <sub>3</sub>	3-піридил
A-482	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-піридин-3-іл
A-483	OCH <sub>3</sub>	2-бром-піридин-3-іл
A-484	OCH <sub>3</sub>	2-метил-піридин-3-іл
A-485	OCH <sub>3</sub>	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-486	OCH <sub>3</sub>	2,4-дибром-піридин-3-іл
A-487	OCH <sub>3</sub>	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-488	OCH <sub>3</sub>	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл

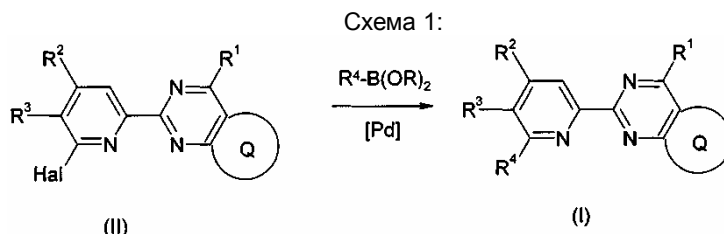
A-489	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-490	OCH <sub>3</sub>	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-491	OCH <sub>3</sub>	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-492	OCH <sub>3</sub>	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-493	OCH <sub>3</sub>	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-494	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-495	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-496	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-497	OCH <sub>3</sub>	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-498	OCH <sub>3</sub>	4-піридил
A-499	OCH <sub>3</sub>	3-хлор-піридин-4-іл
A-500	OCH <sub>3</sub>	3-бром-піридин-4-іл
A-501	OCH <sub>3</sub>	3-метил-піридин-4-іл
A-502	OCH <sub>3</sub>	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-503	OCH <sub>3</sub>	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-504	OCH <sub>3</sub>	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-505	OCH <sub>3</sub>	4-піримідиніл
A-506	OCH <sub>3</sub>	5-хлорпіримідин-4-іл
A-507	OCH <sub>3</sub>	5-фторпіримідин-4-іл
A-508	OCH <sub>3</sub>	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-509	OCH <sub>3</sub>	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-510	OCH <sub>3</sub>	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-511	OCH <sub>3</sub>	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-512	OCH <sub>3</sub>	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-513	OCH <sub>3</sub>	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-514	OCH <sub>3</sub>	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-515	OCH <sub>3</sub>	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-516	OCH <sub>3</sub>	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-517	OCH <sub>3</sub>	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-518	OCH <sub>3</sub>	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-519	OCH <sub>3</sub>	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-520	OCH <sub>3</sub>	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-521	OCH <sub>3</sub>	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-522	OCH <sub>3</sub>	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-523	OCH <sub>3</sub>	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-524	OCH <sub>3</sub>	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-525	OCH <sub>3</sub>	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-526	OCH <sub>3</sub>	5-піримідиніл
A-527	OCH <sub>3</sub>	4-метил-піримідин-5-іл
A-528	OCH <sub>3</sub>	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-529	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-530	OCH <sub>3</sub>	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-531	OCH <sub>3</sub>	2-піримідиніл
A-532	OCH <sub>3</sub>	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-533	OCH <sub>3</sub>	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
A-534	OCH <sub>3</sub>	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-535	OCH <sub>3</sub>	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл
A-536	F	2-тієніл
A-537	F	5-метилтіофен-2-іл
A-538	F	4-метилтіофен-2-іл
A-539	F	5-хлортіофен-2-іл

A-540	F	3-ціанотіофен-2-іл
A-541	F	4-бромтіофен-2-іл
A-542	F	3,5-дихлортіофен-2-іл
A-543	F	3,4,5-трихлортіофен-2-іл
A-544	F	5-бромтіофен-2-іл
A-545	F	3-тієніл
A-546	F	2-метилтіофен-3-іл
A-547	F	2,5-дихлортіофен-3-іл
A-548	F	2-фурил
A-549	F	5-метилфуран-2-іл
A-550	F	5-хлорфуран-2-іл
A-551	F	4-метилфуран-2-іл
A-552	F	3-ціанофуран-2-іл
A-553	F	5-ацетилфуран-2-іл
A-554	F	3,5-дихлорфуран-2-іл
A-555	F	5-бромфуран-2-іл
A-556	F	3-фурил
A-557	F	2-метилфуран-3-іл
A-558	F	2,5-диметилфуран-3-іл
A-559	F	2-піридил
A-560	F	3-фтор-піридин-2-іл
A-561	F	3-хлор-піридин-2-іл
A-562	F	3-бром-2-піридин-2-іл
A-563	F	3-трифторметил-піридин-2-іл
A-564	F	3-метил-піридин-2-іл
A-565	F	3-етил-піридин-2-іл
A-566	F	3,5-дифтор-піридин-2-іл
A-567	F	3,5-дихлор-піридин-2-іл
A-568	F	3,5-дибром-піридин-2-іл
A-569	F	3,5-диметил-піридин-2-іл
A-570	F	3-фтор-5-трифторметил-піридин-2-іл
A-571	F	3-хлор-5-фтор-піридин-2-іл
A-572	F	3-хлор-5-метил-піридин-2-іл
A-573	F	3-фтор-5-хлор-піридин-2-іл
A-574	F	3-фтор-5-метил-піридин-2-іл
A-575	F	3-метил-5-фтор-піридин-2-іл
A-576	F	3-метил-5-хлор-піридин-2-іл
A-577	F	5-нітро-піридин-2-іл
A-578	F	5-ціано-піридин-2-іл
A-579	F	5-метоксикарбоніл-піридин-2-іл
A-580	F	5-трифторметил-піридин-2-іл
A-581	F	5-метил-піридин-2-іл
A-582	F	4-метил-піридин-2-іл
A-583	F	6-метил-піридин-2-іл
A-584	F	3-піридил
A-585	F	2-хлор-піридин-3-іл
A-586	F	2-бром-піридин-3-іл
A-587	F	2-метил-піридин-3-іл
A-588	F	2,4-дихлор-піридин-3-іл
A-589	F	2,4-дибром-піридин-3-іл

A-590	F	2,4-дифторпіридин-3-іл
A-591	F	2-фтор-4-хлорпіридин-3-іл
A-592	F	2-хлор-4-фтор-піридин-3-іл
A-593	F	2-хлор-4-метил-піридин-3-іл
A-594	F	2-метил-4-фтор-піридин-3-іл
A-595	F	2-метил-4-хлор-піридин-3-іл
A-596	F	2,4-диметил-піридин-3-іл
A-597	F	2,4,6-трихлорпіридин-3-іл
A-598	F	2,4,6-трибромпіридин-3-іл
A-599	F	2,4,6-триметил-піридин-3-іл
A-600	F	2,4-дихлор-6-метилпіридин-3-іл
A-601	F	4-піридил
A-602	F	3-хлор-піридин-4-іл
A-603	F	3-бром-піридин-4-іл
A-604	F	3-метил-піридин-4-іл
A-605	F	3,5-дихлор-піридин-4-іл
A-606	F	3,5-дибром-піридин-4-іл
A-607	F	3,5-диметил-піридин-4-іл
A-608	F	4-піримідиніл
A-609	F	5-хлорпіримідин-4-іл
A-610	F	5-фторпіримідин-4-іл
A-611	F	5-фтор-6-хлорпіримідин-4-іл
A-612	F	2-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-613	F	2,5-диметил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-614	F	5-метил-6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-615	F	6-трифторметил-піримідин-4-іл
A-616	F	2-метил-5-фтор-піримідин-4-іл
A-617	F	2-метил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-618	F	5-хлор-6-метил-піримідин-4-іл
A-619	F	5-хлор-6-етил-піримідин-4-іл
A-620	F	5-хлор-6-ізопропіл-піримідин-4-іл
A-621	F	5-бром-6-метил-піримідин-4-іл
A-622	F	5-фтор-6-метил-піримідин-4-іл
A-623	F	5-фтор-6-фторметил-піримідин-4-іл
A-624	F	2,6-диметил-5-хлор-піримідин-4-іл
A-625	F	5,6-диметил-піримідин-4-іл
A-626	F	2,5-диметил-піримідин-4-іл
A-627	F	2,5,6-триметил-піримідин-4-іл
A-628	F	5-метил-6-метокси-піримідин-4-іл
A-629	F	5-піримідиніл
A-630	F	4-метил-піримідин-5-іл
A-631	F	4,6-диметил-піримідин-5-іл
A-632	F	2,4,6-триметилпіримідин-5-іл
A-633	F	4-трифторметил-6-метил-піримідин-5-іл
A-634	F	2-піримідиніл
A-635	F	4,6-диметилпіримідин-2-іл
A-636	F	4,5,6-триметилпіримідин-2-іл
№	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
A-637	F	4,6-дитрифторметил-піримідин-2-іл
A-638	F	4,6-диметил-5-хлор-піримідин-2-іл

Відповідно до винаходу сполуки загальної формули I можуть бути одержані по аналогії з наведеним на початку рівнем техніки за допомогою стандартних методів органічного синтезу.

Сполуки формули I можуть бути одержані, наприклад, відповідно до способу, зображеного на схемі 1:



В схемі 1 Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> і R<sup>4</sup> мають наведені вище значення. R означає H або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл або утворює з іншими молекулами R<sup>4</sup>-B(OR)<sub>2</sub> ангідрид фенолборної кислоти. Hal означає бром або йод.

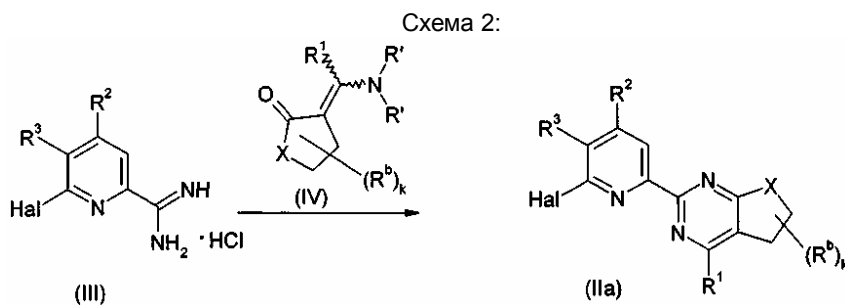
Відповідно до схеми 1 2-(6-галогенпіридин-2-іл)піримідин формули II піддається взаємодії з похідним (гет)арилборної кислоти загальної формули R<sup>4</sup>-B(OR)<sub>2</sub> при умовах сполучення Сузукі (Suzuki), тобто в присутності паладієвого каталізатора при відомих умовах реакції, як вони, наприклад, відомі з Ace. Chem. Res. 15, стор.178-184 (1982), Chem. Rev. 95, стор.2457-2483 (1995), і процитованих там літературних джерел, а також з J. Org. Chem. 68, стор.9412 (2003). Придатними каталізаторами є особливо тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0), хлорид біс(трифенілфосфін)паладію(II), хлорид біс(ацетонітрил)паладію(II), хлорид-дихлорметановий комплекс [1,1'-біс-(дифенілфосфіно)ферроцен]паладію(II), біс-[1,2-біс(дифенілфосфін)етан]паладій(0) і хлорид [1,4-біс(дифенілфосфін)бутан]паладію(II). Кількість каталізатора становить звичайно від 0,1 до

10 моль-%, в перерахуванні на сполуку II. Молярне відношення сполуки II до похідного (гет)арилборної кислоти типово знаходиться в межах від 1:2 до 2:1.

Замість похідного арилборної кислоти також можуть використатися металоорганічні сполуки Met-R<sup>4</sup>, де R<sup>4</sup> має зазначене вище значення і Met означає залишок MgX, SnR<sub>3</sub> або ZnX (X=хлор, бром або йод, R=алкіл). Взаємодія II зі сполукою Met-R<sup>4</sup> відбувається потім, наприклад, в змісті сполучення Стіллі (Stille) або сполучення Кумада (Kumada).

3-(6-галогенпіридин-2-іл)-піримідини формули II частково є відомими, наприклад, з заявки WO 2006/010570 або зі свого боку можуть бути одержані відповідно до методів, зображених на наведених нижче схемах з відповідних амідинових сполук формули III.

Одержання сполуки II, де Q являє собою насичений карбоцикл Q-1 відповідно до зазначеного вище визначення, вдається, наприклад, відповідно до синтезу, зображеного на схемі 2.



В схемі 2 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, Hal, R<sup>b</sup>, X і k мають наведені вище значення. R<sup>1</sup> особливо означає водень. R' означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл і особливо метил. Відповідно до схеми 2 гідрохлорид піридин-2-іл-амідинію формули III взаємодіє з діалкіламінометиленциклоалканонам формули IV (єнамінокетон IV) в присутності основи, переважно алкогляту лужного металу, такого як метилат натрію або етилат натрію. Взаємодія може бути здійснена по аналогії з відомим способом до взаємодії гідрохлоридів амідинію з єнамінокетонами, як вони описані, наприклад, в J. Heterocycl. Chem. 20, стор.649-653 (1983). Замість єнамінокетонів IV також можуть використатися β-оксоацеталі формули IVa.



В формулі IVa R'' означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл і особливо метил або етил. R<sup>1</sup> особливо означає водень. Взаємодія III з IVa може здійснюватися по аналогії з методом, описаним в EP-A 259139 (a), на що тим самим робиться посилання.

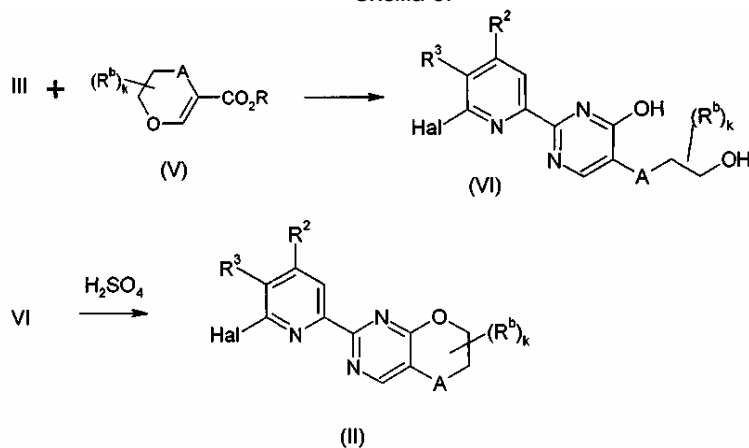
Діалкіламінометиленциклоалканони формули IV є відомими або можуть бути одержані за зразком відомих методів [див. наприклад, WO

2001/087845, Tetrahedron 50(7), стор.2255-2264 (1994); Synthetic Communications 28(10), 1743-1753 (1998) або Tetrahedron Letters 27(23), 2567-70 (1986)].  $\beta$ -оксоацеталі формули IVa рівним чином є

відомими, наприклад, з EP 259139, або можуть бути придбані в комерційних мережах.

Сполуки формули II, в якій Q означає Q-2 або Q-3 і  $R^1$  означає водень, одержують шляхом синтезу, наведеним на схемі 3:

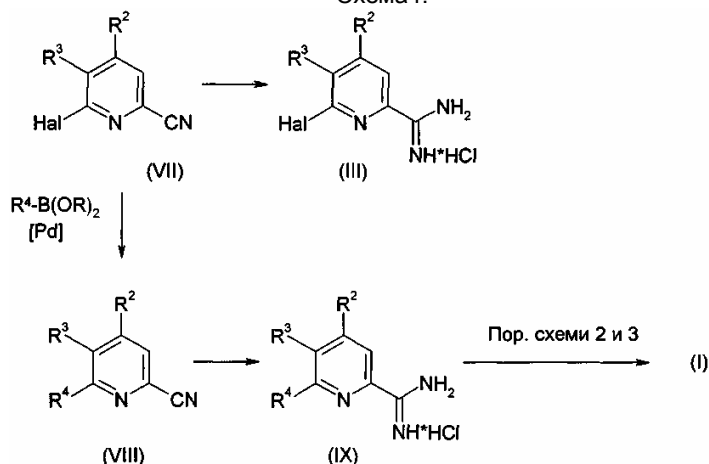
Схема 3:



В схемі 3 Hal, k,  $R^b$ ,  $R^2$  і  $R^3$  мають значення наведені вище. А означає  $CH_2$  або хімічний зв'язок. R означає  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, особливо метил або етил. Відповідно до схеми 3 амідинова сполука III в присутності основи, наприклад, алкоголяту лужного металу, такого як метилат натрію або етилат натрію в метанолі або етанолі, при від 60 до  $90^\circ C$  послідовно піддається взаємодії зі складними ефіром формули V. Якщо III використовувати не як гідрохлорид, в такому випадку можна відмовитися від додавання основи (Liebigs Ann. Chem. 1974, сс. 468-476). Одержана таким чином бисгідрокси сполука формули VI потім піддається циклічній дегідратації, наприклад, шляхом обробки сірчаною кислотою. Складні ефіри формули V є відомими або можуть бути одержані аналогічно способам, відомим з літературних джерел (див. J. Heterocycl. Chem., 32 (1995) стор.735 і Liebigs Ann. Chem. 1974, стор.468-476).

Сполуки загальної формули III зі свого боку можуть бути одержані з відповідних 2-ціанопіридинових сполук загальної формули VII (див. схему 4). Для цього 2-ціанопіридину сполуку VII відповідно до методу, описаного в US 4,873,248 шляхом послідовної обробки алкоголятом лужного металу, таким як метанолат натрію або етанолат натрію і наступною взаємодією з хлоридом амонію переводять в сполуку III. Замість гідрохлоридів в зазначених на схемах з 1 по 3 послідовних стадіях можуть використатися також гідроброміди, ацетати, сульфати або форміати. Ціанопіридини формули VII є відомими, наприклад, з US 2003/087940, WO 2004/026305, WO 01/057046 і Bioorg. Med. Chem. Lett, стор.1571-1574 (2003) або можуть бути одержані відповідно до відомих способів одержання.

Схема 4:



Відповідно до другого шляху синтезу (див. схему 4) сполуки відповідно до винаходу, можуть

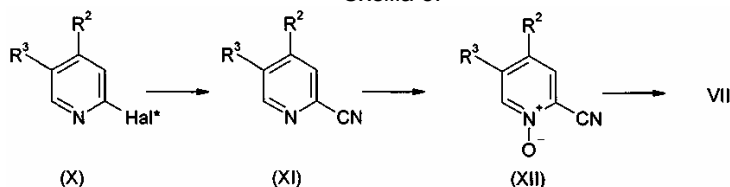
бути одержані виходячи з ціанопіридинів VII. Для цього спочатку здійснюють сполучення сполуки VII

зі сполукою (гет)арилборної кислоти  $R^4-B(OR)_2$ , як описано для схеми 1, і при цьому одержаний 6-(гет)арил-2-ціанопіридин при описаних для сполуки VII умовах реакції перетворюють в амідинову сполуку IX. Тоді сполука IX при зазначених для

схем 2 і 3 умовах може бути переведена у відповідну сполуку формули I.

Сполуки загальної формули VII, оскільки не є відомими, особливо можуть бути одержані відповідно до наведеного на схемі 5 способу.

Схема 5:



В схемі 5  $R^2$  і  $R^3$  мають значення наведені вище. Hal\* означає хлор, бром або йод.

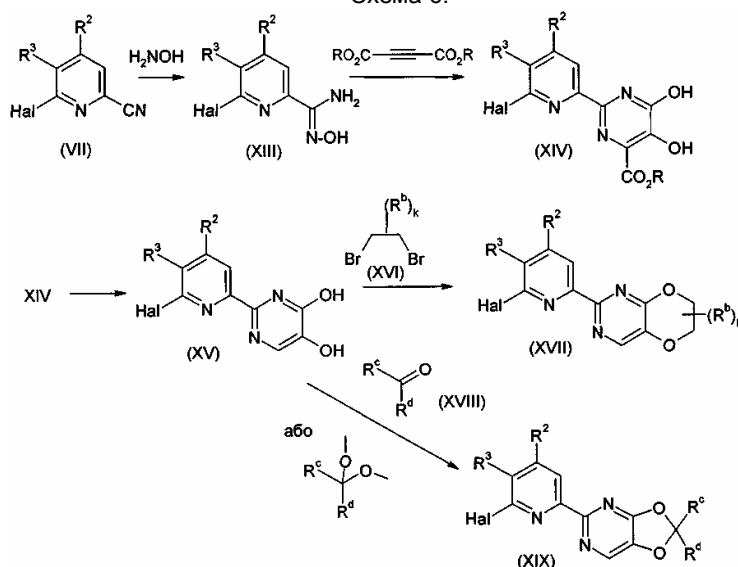
Перетворення 2-галогенпіридину X в 2-ціанопіридин XI вдається досягти згідно зі стандартними методами органічної хімії шляхом взаємодії X з іонами ціаніду, наприклад, з ціанідом натрію або ціанідом калію (див. EP-A 97460, приклад одержання 1), ціанідом міді(I) (див. EP-A 34917, приклад одержання 3) або триметилсилілціанідом. Потім одержану таким чином сполуку XI шляхом обробки надкислотою відповідно до відомих методів перетворюють в N-оксид XII піридину. Перетворення XI в XII може здійснюватися по аналогії з відомими способами, наприклад, шляхом обробки XI пероксидом водню в органічній кислоті, такий як мурашина кислота, оцтова кислота, хлороцтова кислота або трифтороцтова кислота (див. наприклад, J. Org. Chem. 55, стор.738-741 (1990) і Organic Synthesis, Collect, т. IV, стор.655-656 (1963)) або шляхом взаємодії XI з органічною надкислотою, такою як мета-хлорпербензойна кислота в інертному розчиннику, наприклад, галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан (див. наприклад, Synthetic Commun. 22(18), S. 2645, (1992); J. Med. Chem. 2146 (1998)). Перетворення XI в XII вдається здійснити також по аналогії з описаним методом К. В. Sharpless (J. Org. Chem. 63(5), стор.7740 (1998)) шляхом взає-

модії XI з пероксидом водню в галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан в присутності каталітичних кількостей (наприклад, 5мас.-%) сполуки  $\text{reNiK}(\text{VII})$ , такого як метилтриоксореній ( $\text{H}_3\text{CReO}_3$ ).

Потім XII піддають взаємодії з засобом, що галогенує, таким як  $\text{POCl}_3$  або  $\text{POBr}_3$ , причому одержують відповідну сполуку VII. Для взаємодії XII до одержання VII використовують засіб, що галогенує, як правило, в надлишку, в перерахуванні на стехіометрію реакції. Взаємодія може бути проведена в інертному органічному розчиннику і часто здійснюють при відсутності розчинника, причому в такому випадку, як правило, засіб, що галогенує діє як розчинник. Температура реакції знаходиться звичайно в межах від  $20^\circ\text{C}$  до температури кипіння засобу, що галогенує. При необхідності є вигідним, спочатку за допомогою засобу, що хлорує, такого як  $\text{POCl}_3$  один атом хлору ввести в 2-положення N-оксиду піридину XII і потім зробити галогенний обмін, наприклад, шляхом обробки  $\text{HBr}$  або засобом, що йодує, причому одержують сполуку формули VII з  $\text{Hal}=\text{Br}$  або  $\text{I}$ .

Сполуки формули II, в якій Q означає залишок Q-5 або Q-7 і  $R^1$  означає водень, крім того, можуть бути одержані відповідно до наведеного на схемі 6 шляхом синтезу з 2-ціанопіридинових сполук формули VII:

Схема 6:



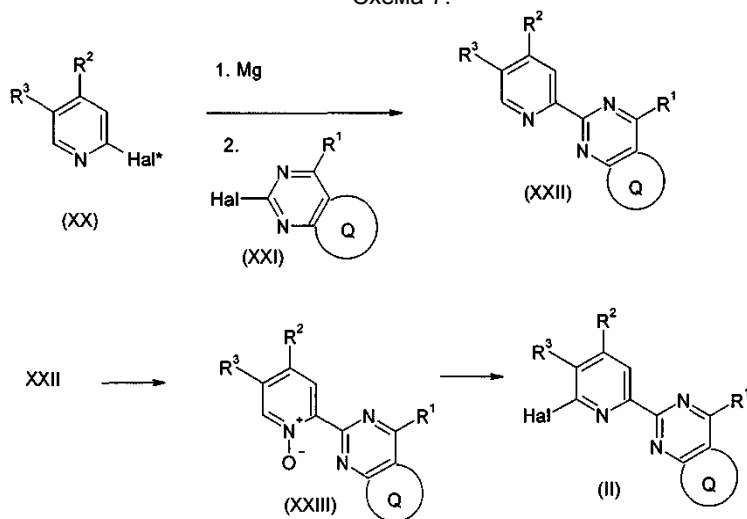
В схемі 6  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^b$  і  $k$  мають наведені вище значення.  $R$  означає  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, особливо метил.  $R^c$  і  $R^d$  незалежно один від іншого означають водень або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл.

На першій стадії 2-гало-6-ціанопіридин VII піддається взаємодії з гідроксиламіном або гідрохлоридом гідроксиламіну в присутності основи, такої як карбонат калію. Взаємодія може здійснюватися по аналогії з Farmaco, Ed. Sci., 41 (1986) стор.499. Одержаний таким чином N-гідроксиамідин XIII потім піддається взаємодії зі складним ефіром ацетилендикарбонової кислоти, причому одержують 2-(2-галогенпіридин-6-іл)-4,5-бисгідрокси-6-алкоксикарбонілпіримідин XIV. Взаємодія XIII зі складним ефіром ацетилендикарбонової кислоти може здійснюватися по аналогії з J. Heterocycl. Chem. 16 (1979) 1423. Сполуку XIV потім омилюють лугом, наприклад, шляхом обробки гідроксидом натрію або гідроксидом калію і потім декарбо-

ксилюють шляхом обробки водною кислотою, наприклад, шляхом обробки розведеною соляною кислотою, причому одержують 2-(2-галогенпіридин-6-іл)-4,5-бисгідроксипіримідин XV. Одержаний таким чином бисгідроксипіримідин XV може потім піддаватися взаємодії з 1,2-дибромалканом XVI, переважно в присутності основи, такої як гідроксид лужного металу або алкоголят лужного металу по аналогії з методом, описаним в Heterocycl. Chem. 27, стор.151 (1990), причому одержують конденсований піримідин XVII. Крім того, бисгідроксипіримідин XV може піддаватися взаємодії по аналогії з методом, описаним в Chem. Berichte 124 (3) 481 (1991); J. Chem. Soc., Perkin Trans 1 стор.3561 (1998); Synthesis стор.122 (1986) з кетоном, відповідно альдегідом XVIII, причому одержують конденсований піримідин XIX.

Інший підхід до сполук загальної формули II пояснений на схемі 7.

Схема 7:



В схемі 7  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  і  $Q$  мають значення наведені вище.  $Hal^*$  означає хлор, бром або особливо йод.  $Hal$  означає хлор або бром.

Відповідно до схеми 7 спочатку галогенпіридин формули XX шляхом взаємодії з магнієм переводять у відповідну сполуку Грин'яра, яку потім сполучають з 2-галогенпіримідиною сполукою XXI. Одержання сполуки Грин'яра може здійснюватися згідно з відомими способами, як вони, наприклад, описані в Synlett стор.1359 (1998). Наступне сполучення зі сполукою 2-галогенпіримідину XXI відбувається звичайно в присутності каталізатора перехідного металу металів з груп з 8 по 10 (згідно з ІЮПАК 1989), особливо паладієвого, нікелевого або залізного каталізатора. Стосовно цього посилення робиться на вищенаведені каталізатори. Взаємодія відбувається в звичайному для цього розчиннику, наприклад, простому ефірі, такому як діетиловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран, ароматичному вуглеводні, такому як толуол або ксилол, або апротонному аміді, лактамі або сечовині, такий як N-метилпірролідон або диметилпропіленсечовина або в сумішах цих розчинників, особливо сумішах, які, щонайменше, містять один

простий ефір. Температури реакції, як правило, знаходяться в межах від  $-40$  до  $+120^\circ\text{C}$  і особливо в межах від  $20$  до  $100^\circ\text{C}$ . Що стосується інших подробиць, то посилання робиться на методи, описані в J. Am. Chem. Soc. 124, стор.13856 (2002), Chem. Pharm. Bull., стор.4533 (1983) і Chem. Pharm. Bull., стор.2005 (1984), які аналогічним чином можуть застосовуватися для сполучення XX з XXI.

Одержану таким чином сполуку XXII потім переводять в N-оксид XXIII. Перетворення XXII в 2-фенілпіридин-N-оксид формули XXIII може здійснюватися по аналогії з відомими способами, наприклад, шляхом обробки XXII пероксидом водню в органічній кислоті, такий як мурашина кислота, оцтова кислота, хлороцтова кислота або трифтороцтова кислота (див. наприклад, J. Org. Chem. 55, стор.738-741 (1990) і Organic Synthesis, Collect. t.IV, стор.655-656 (1963)) або шляхом взаємодії XXII з органічною надкислотою, такий як метаклорпербензойна кислота в інертному розчиннику, наприклад, галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан (див. наприклад, Synthetic Commun. 22(18), стор.2645, (1992); J.



Med. Chem. 2146 (1998)). Перетворення XXII на XXIII вдається також здійснити по аналогії з методом, описаним в К. В. Sharpless (J. Org. Chem. 63(5), стор.7740 (1998)) шляхом взаємодії XXII пероксидом водню в галогенованому вуглеводні, такому як дихлорметан або дихлоретан в присутності каталітичних кількостей (наприклад, 5мас.-%) сполуки ренію(VII), такого як метилтриоксореній ( $\text{H}_3\text{CrReO}_3$ ).

Потім N-оксид XXIII по аналогії з наведеним на схемі 5 перетворенням XI в XII піддають взаємодії з засобом, що галогенує, таким як  $\text{POCl}_3$  або  $\text{POBr}_3$  і при необхідності здійснюють галогенний обмін, причому одержують сполуку 2-галоген II. Яка потім згідно з наведеним на з схемі 1 методом піддають взаємодії зі сполукою (гет)арилборної кислоти або відповідною сполукою Грин'яра, причому одержують сполуку загальної формули I.

Сполуки загальної формули XX є відомими або можуть бути одержані відповідно до відомих методів органічної хімії (див. наприклад, US 6,040,448, WO 99/21850 і Chem. Pharm. Bull. стор.2254 (1983)).

Одержані згідно з зображеними на схемах з 1 по 7 методами реакційні суміші переробляють звичайним способом, наприклад, шляхом змішування з водою, розділення фаз і при необхідності хроматографічного очищення вихідних продуктів. Проміжні і кінцеві продукти утворюються частково у вигляді безбарвних або злегка коричнюватих грузлих олій, які при зниженому тиску і при помірно підвищеній температурі звільняються або очищуються від летких компонентів. Оскільки проміжні і кінцеві продукти одержують як тверді речовини, очищення може також здійснюватися шляхом перекристалізації або дигерування.

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

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

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

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

Особливо вони придатні для боротьби з наступними захворюваннями рослин:

- види *Alternaria* на овочах, рапсі, цукровому буряку, фруктах, рисі, соєвих бобах, а також на картоплі (наприклад, *A. solani* або *A. alternate*) і томатах

- (наприклад, *A. solani* або *A. alternate*) і *Alternaria* ssp. (колосова чернь) на пшениці,

- види *Aphanomyces* на цукровому буряку і овочах,

- види *Ascochyta* на зернових і овочах, наприклад, *Ascochyta tritici* (аскохітоз) на пшениці,

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

- *Blumeria graminis* (справжня борошниста роса) на зернових (наприклад, пшениці або ячмені),

- *Botrytis cinerea* (сіра гнилизна) на полуниці, овочах, квітах, пшениці і виноградних лозах,

- *Bremia lactucae* на салаті,

- види *Cercospora* на кукурудзі, соєвих бобах, рисі і цукровому буряку і наприклад, *Cercospora sojae* (церкоспороз сої) або *Cercospora kikuchii* (церкоспороз пурпурний) на соєвих бобах,

- *Cladosporium herbarum* (колосова чернь) на пшениці,

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

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

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

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

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

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

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

- *Elsinoe ampelina* на виноградній лозі,

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

- *Exserohilum* види на кукурудзі,

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

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

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

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

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

- Grainstaining complex на рисі,

- *Guignardia budwellii* на виноградній лозі,
- види *Helminthosporium* (наприклад, *H. graminicola*) на кукурудзі і рисі,
- *Isariopsis clavispora* на виноградній лозі,
- *Macrophomina phaseolina* (коренева/стеблова гнилизна) на соєвих бобах,
- *Microdochium nivale* на зернових (наприклад, на пшениці або ячмені),
- *Microsphaera diffusa* (справжня борошниста роса) на соєвих бобах,
- види *Mycosphaerella* на зернових, бананах і земляному горі (M. *graminicola* на пшениці, M. *fijiesis* на банані),
- види *Peronospora* на капусті (наприклад, *P. brassicae*), на луковичних рослинах (наприклад, *P. destructor*) і наприклад, *Peronospora manshurica* (Falscher Mehltau) на соєвих бобах,
- *Phakopsara pachyrhizii* *Phakopsara meibomiae* на соєвих бобах,
- *Phialophora gregata* (захворювання стебла) на соєвих бобах,
- види *Phomopsis* на соєвих бобах, соняшнику і виноградних лозах (*P. Viticola* на виноградних лозах, *P. helianthii* на соняшнику),
- види *Phytophthora* на різних рослинах, наприклад, *P. capsici* на паприці,
- *Phytophthora megasperma* (листява/стеблова гнилизна) на соєвих бобах,
- *Phytophthora infestans* на картоплі і помідорах,
- *Plasmopara viticola* на виноградних лозах,
- *Podosphaera leucotricha* на яблунях,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* на зернових,
- *Pseudoperonospora* види на хмелю і баштанних (наприклад, *P. cubensis* на огірках або *P. humili* на хмелю)
- *Pseudopeziza tracheiphila* на виноградній лозі,
- види *Puccinia* на різних рослинах, наприклад, *P. trititica*, *P. striiformis*, *P. hordei* або *P. graminis* на зернових (наприклад, пшениці або ячмені) або на спаржі (наприклад, *P. asparagi*),
- види *Rugophthora* на зернових,
- *Pyricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* на рисі,
- *Pyricularia grisea* на дернині і зернових,
- *Pythium* spp. на дернині, рисі, кукурудзі, бавовнику, рапсі, соняшнику, цукровому буряку, овочах і інших рослинах (наприклад, *P. ultimum* або *P. aphanidermatum*),
- *Ramularia collo-cygni* (рамуляріоз/сонячно-опіковий комплекс / фізіологічні опіки листя) на ячмені,
- види *Rhizoctonia* (наприклад, *R. solani*) на бавовнику, рисі, картоплі, дернині, кукурудзі, рапсі, цукровому буряку, овочах і інших рослинах, наприклад, *Rhizoctonia solani* (коренева/стеблова гнилизна) на соєвих бобах або *Rhizoctonia cerealis* (гострокінцева очна плямистість) на пшениці або ячмені,
- *Rhynchosporium secalis* на ячмені (листяна плямистість), житі і тритикалі,
- *Sclerotinia* види на рапсі, соняшнику і інших рослинах, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum* (за-

- хворювання стебла) або *Sclerotinia rolfsii* (захворювання стебла) на соєвих бобах,
- *Septoria glycines* (листяна плямистість) на соєвих бобах,
- *Septoria tritici* *Stagonospora nodorum* на пшениці,
- *Erysiphe* (син. *Uncinulanecator*) на виноградній лозі,
- *Setosphaeria* види на кукурудзі і дернині,
- *Sphacelotheca reilina* на кукурудзі,
- *Stagonospora nodorum* (септорій колосся) на пшениці,
- *Thievaliopsis* види на соєвих бобах і бавовнику,
- *Tilletia* види на зернових,
- *Typhula incarnata* (снігова гнилизна) на пшениці або ячмені,
- *Ustilago* види на зернових, кукурудзі і цукровому буряку і
- *Venturia* види (парша) на яблунях і грушах (наприклад, *V. inaequalis* на яблунях).

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

Аскоміцети, такі як *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; базидіоміцети, такі як *Coniophoraspp.*, *Coriolusspp.*, *Gloeophyllumspp.*, *Lentinus* spp., *Pleurotus*spp., *Poria* spp., *Serpulaspp.* і *Tyromycesspp.*, дейтероміцети, такі як *Aspergillus*spp., *Cladosporium*spp., *Penicillium*spp., *Trichoderma*spp., *Alternaria* spp., *Paecilomycesspp.* і зигоміцети, такі як *Mucorspp.*, крім цього для захисту матеріалів наступні дріжджові грибки: *Candida* spp. і *Saccharomyces cerevisiae*.

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

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

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

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

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

Сполуки формули I можуть знаходитися в різних кристалічних модифікаціях, які можуть різни-

тися своєю біологічною ефективністю. Вони рівним чином є об'єктом даного винаходу.

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

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

- вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти Solvesso, ксилол), парафіни (наприклад, фракції сирої нафти), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гамма-бутиролактон), піролідони (N-метилпіролідон, N-октилпіролідон), ацетати (глікольдіацетат), гліколи, аміді диметиллових кислот жирного ряду, кислоти жирного ряду й складні ефіри кислот жирного ряду. У принципі також можуть застосовуватися суміші розчинників,
- носії, такі як природні гірські породи (наприклад, каоліни, глинозем, тальк, крейда) і синтетичні гірські породи (наприклад, високодисперсна кремнієва кислота, силікати); емульгатори, такі як неіоногенні й аніонні емульгатори (наприклад, прості ефіри поліоксиетиленових спиртів жирного ряду, алкілсульфонати й арилсульфонати) і диспергатори, такі як лігнінсульфітні відпрацьовані луґи й метилцелюлоза.

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

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

логексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

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

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

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

Приклади композицій:

1. Продукти для розведення в воді

A Водорозчинні концентрати (SL, LS)

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

B Здатні до диспергування концентрати (DC)

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

C Здатні до емульгування концентрати (EC)

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

D Емульсії (EW, EO, ES)

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

E Суспензії (SC, OD, FS)

20мас.част. діючих речовин при додаванні 10мас. частин диспергатора й змочувального агента й 70мас. частин води або органічного розчинника подрібнюють у кульовому млині з мішалкою до тонкої суспензії діючої речовини. При розве-

денні у воді утворюється стабільна суспензія діючої речовини. Вміст діючої речовини в композиції становить 20мас.%.  
 F Здатні до диспергування у воді й водорозчинні грануляти (WG, SG)

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

G Здатні до диспергування у воді й водорозчинні порошки (WP, SP, SS, WS)

75мас.част. діючих речовин перемелюються при додаванні 25мас. частин диспергатора й змочувального агента, а також силікагелю в роторно-статорному млині. При розведенні у воді утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої речовини. Вміст діючої речовини в композиції становить 75мас.%.  
 H Гелеві композиції (GF)

У кульовому млині перемелюють 20мас. частин сполуки I відповідно до винаходу, 10мас. частин диспергатора, 1мас. частину желувального агента і 70мас. частин води або органічного розчинника до утворення тонкої суспензії. При розведенні водою одержують стабільну суспензію з вмістом діючої речовини в 20мас. частин.

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

5мас. частин діючих речовин тонко подрібнюють і ретельно перемішують з 95мас. частин тонкодисперсного каоліну. Внаслідок чого одержують засіб для обпилення з вмістом діючої речовини 5мас.%.  
 J Грануляти (GR, FG, GG, MG)

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

10мас. частин діючих речовин розчиняють в 90мас. частин органічного розчинника, наприклад, ксилолу. Внаслідок чого одержують продукт для безпосереднього застосування з вмістом діючої речовини 10мас.%.  
 Для обробки посівного матеріалу звичайно застосовують водорозчинні концентрати (LS), суспензії (FS), порошки (DS), порошки, що диспергуються у воді й водорозчинні порошки (WS, SS), емульсії (ES), здатні до емульгування концентрати (EC) і гелеві композиції (GF). Ці композиції можуть застосовуватися на посівний матеріал нерозбавленими або, переважно, розведеними. Застосування може здійснюватися перед посівом.

Діючі речовини можуть застосовуватися як такі, у формі своїх композицій або в приготовлених з них формах застосування, наприклад, використа-

тися у формі розчинів призначених для безпосереднього обприскування, порошоків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, препаратів для обпилювання, препаратів для опудрювання або гранулятів і можуть застосовуватися шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилювання, опудрювання або поливу. Форми застосування залежать від мети використання; у всякому разі повинне бути забезпечене максимально тонкий і рівномірний розподіл діючих речовин відповідно до винаходу.

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

Концентрації діючих речовин у готових до застосування композиціях можуть варіюватися в широкому діапазоні. Загалом, такі концентрації становлять від 0,0001 і до 10%, переважно від 0,01 до 1%.

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

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

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

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

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

### Стробілурини

азоксистробін, димоксистробін, еностробурин, флуоксистробін, крезоксим-метил, метоміностробін, пікоксистробін, піраклостробін, трифлуксистробін, оризастробін, (2-хлор-5-[1-(3-метилбензилоксиіміно)-етил]-бензил)-складний метиловий ефір карбамінової кислоти, (2-хлор-5-[1-(6-метил-піридин-2-илметоксиіміно)-етил]-бензил)-складний метиловий ефір карбамінової кислоти, 2-(орто-(2,5-диметил-феніл-оксиметил)-феніл)-3-метокси-складний метиловий ефір акрилової кислоти;

### Аміди карбонової кислоти

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

- морфоліди карбонової кислоти: диметоморф, флуморф;

- аміди бензойної кислоти: флуметовер, флупіколід (пікобензамід), зоксамід;

- інші аміди карбонової кислоти: карпропамід, диклоцимет, мандипропамід, N-(2-(4-[3-(4-хлор-феніл)-проп-2-інілокси]-3-метокси-феніл)-етил)-2-метансульфоніламіно-3-метил-бутирамід, N-(2-(4-[3-(4-хлор-феніл)-проп-2-інілокси]-3-метокси-феніл)-етил)-2-етансульфоніламіно-3-метил-бутирамід;

### Азолі

- триазолі: бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифенокконазол, диніконазол, енілконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флузілазол, флуквінконазол, флутріафол, гексаконазол, імібенконазол, Ірконазол, метконазол, миклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, протіконазол, сімеконазол, тебуконазол, тетраконазол, тріадименол, тріадимефон, тритіконазол;

- імідазоли: циазофамід, імазаліл, пефуразоат, прохлораз, трифлумізол;

- бензімідазоли: беноміл, карбендазим, фуберідазол, тіабендазол;

- інші: етабоксам, етридіазол, гимексазол;

Сірковмісні гетероциклічні сполуки

- піридини: флузінам, пирифенокс, 3-[5-(4-хлор-феніл)-2,3-диметил-ізоксазолидин-3-іл]-піридин;

- піримідини: бупіримат, ципродиніл, феримзон, фенаримол, мепанипірим, нуаримол, пириметаніл;

- піперазини: трифорин;

- піролі: флудіоксоніл, фенпиклоніл;

- морфоліни: алдиморф, додеморф, фенпропиморф, тридеморф;

- дикарбоксиміди: іпродион, процимідон, вінклозолин;

інші: ацибензолар-S-метил, анилазин, каптан, каптафол, дазомет, дикломезин, феноксанил, фолпет, фенпропидин, фамоксадон, фенамідон, октилінон, пробеназол, проквіназид, пироквілон, квіноксифен, трициклазол, 5-хлор-7-(4-метилпиперидин-1-іл)-6-(2,4,6-трифтор-феніл)-[1,2,4]тріазоло[1,5-а]піримідин, 2-бутоксигідо-3-пропіл-хромен-4-он, 3-(3-бром-6-фтор-2-метиліндол-1-сульфоніл)-[1,2,4]тріазол-1-диметиламід сульфонові кислоти;

### Карбамати і дитіокарбамати

- дитіокарбамати: фербам, манкозев, манеб, метирам, метам, пропинеб, тирам, цинеб, цирам;

- карбамати: диетифенкарб, флубентіавалікарб, іпроваликарб, пропамоккарб, складний метиловий ефір 3-(4-хлорфеніл)-3-(2-ізопропоксикарбоніламіно-3-метил-бутириламіно)-пропіонової кислоти, (4-фторфеніл)складний ефір N-(1-(1-(4-ціанофеніл)етансульфоніл)-бут-2-іл) карбамінової кислоти;

### Інші фунгіциди

- гуанідини: додин, іміноктадин, гуазатин;

- антибіотики: казугаміцин, поліоксин, стрептомицин, валідаміцин А;

- металоорганічні сполуки: фентиніві солі;

- сірковмісні гетероциклічні сполуки: ізопротіолан, дитіанон;

- фосфорорганічні сполуки: едифенфос, фосетил, фосетил-алюмінію, іпробенфос, піразофос, толклофосметил, фосфориста кислота та її солі;

- хлорорганічні сполуки: тіофанат метил, хлороталонил, дихлофлуанід, толілфлуанід, флусульфамід, фталід, гексахлорбензен, пенцикурон, квінтозен;

- похідні нітрофеніла: бинапакрил, динокап, динобутон;

- неорганічні діючі речовини: бордоська рідина, ацетат міді, гідроксид міді, оксихлорид міді, основний сульфат міді, сірка;

- інші: спіроксамин, цифлуфенамід, цимоксаніл, метрафенон.

### Приклади одержання:

Приклад 18: 2-(5'-метокси-3-метил-[2,2]-біпіридину-6-іл)-5,6,7,8-тетрагідро-хіназолін

18.1 6-бром-5-метилпіридин-2-карбоксамідінгідрохлорид

К 4,90г (25ммоль) 6-бром-5-метилпіридин-2-карбонітрила (для одержання, див. US 2003/0087940 A1 і Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003)) в 60мл метанолу додають 2,2г 30%-ого розчину метилату натрію в метанолі і перемішують 7 годин при 23°C. Потім додають 1,5г хлориду амонію і залишають перемішуватися 8 годин при 23°C. Після видалення розчинника змішують з простим метил-трет-бутиловим ефіром і продукт відсмоктують, причому одержують 4,2г білої твердої речовини, яку використовують в наступній стадії без очищення.

18.2 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-5,6,7,8-тетрагідрохіназолін

До розчину 4,2г (7ммоль) гідрохлориду 6-бром-5-метилпіридин-2-карбоксамідину в 100мл метанолу додають 3,6г метилату натрію (30%-ий розчин в метанолі). Через 30хв. змішують з від 3,1г (20ммоль) 2-диметиламінометиленициклогексанона

[для одержання див. US 2004132708; European Journal of Organic Chemistry 10, 2485 (1999); Synthetic Communications 28(10), 1743 (1998)] і перемішують 2 години в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин розподіляють між водою і простим метил-трет-бутиловим ефіром. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують через силікагель за допомогою циклогексан/простий метил-трет-бутиловий ефір (1:1), причому одержують 2,2г сполуки, зазначеного в заголовку.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 1,7-1,8 (m); 2,4 (s); 2,7 (m); 3,0 (m); 7,6 (m); 8,3 (m); 8,7 (s).

18.3 2-(5'-метокси-3-метил-[2,2]-бипіридиніл-6-іл)-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін

До розчину 0,3г 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-5,6,7,8-тетрагідрокіназоліна в 16мл диметоксиетана додають по черзі 0,24г 2-метокси-5-піридинборної кислоти і 0,26г карбонату натрію в 12мл води. Після додавання приблизно 30мг дихлориду [1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан]-палладію(II) нагрівають 4 години при помішуванні в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин розподіляють між водою і простим метил-трет-бутиловим ефіром. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують через силікагель за допомогою циклогексан/простий метил-трет-бутиловий ефір (3:1) і метил-трет-бутиловий ефір/етанол (9:1). Продукт потім змішують з простим метил-трет-бутиловим ефіром і пентаном. Одержують 0,16г сполуки, зазначеного в заголовку з точкою плавлення в 157-158°C.

Приклад 39: 2-(3-метил-[2,4']-бипіридиніл-6-іл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-циклогепта-піримідин

39.1 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-циклогептапіримідин

До розчину 30г (120ммоль) гідрохлориду 6-бром-5-метилпіридин-2-карбоксамідину з прикладу 18.1 в 300мл метанол додають 51,7г метилату натрію (30%-ий розчин в метанолі). Через 30хв. змішують з 30г (180ммоль) 2-диметиламінометилен-циклогептанона [для одержання див. Tetrahedron 50(7), 2255-64 (1994); Synthetic Communications 28(10), 1743-1753 (1998) і Tetrahedron Letters 27(23), 2567-70 (1986)] і перемішують 5 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після чого з реакційного розчину під вакуумом видаляють розчинник і залишок хроматографують через силікагель за допомогою циклогексан/простий метил-г/оет-бутиловий ефір (3 :1) і простий метил-трет-бутиловий ефір/EtOH (9:1). Одержаний продукт потім протягом 30 хвилин домішують в 250мл п-пентану і додають трохи простого метил-трет-бутилового ефіру. Одержують 20г сполуки, зазначеного в заголовку.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,5 (s); 2,8 (m); 3,1 (m); 7,6 (m); 8,3 (m); 8,5 (s).

39.2 Одержання 2-(3-метил-[2,4']-бипіридиніл-6-іл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-циклогептапіримідин

До розчину 0,3г 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-циклогептапіримідину і 16мл диметоксиетану додають по черзі 0,17г 4-піридин-борної кислоти і 0,25г карбонату натрію в 12мл води. Після додавання приблизно 30мг дихлориду [1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан]-палладію(II) перемішують 4 години в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього реакційний розчин розподіляють між водою і простим метил-трет-бутиловим ефіром. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують через силікагель за допомогою простого метил-трет-бутилового ефіру/етанол (4:1), причому одержують 0,15г сполуки, зазначеного в заголовку з точкою плавлення від 198 до 200°C.

Приклад 80: 2-[6-(2,3-дифторфеніл)-5-метил-піридин-2-іл]-7,8-дигідро-5Н-пірано-[4,3- $\text{cl}_3$ -піримідин

80.1 Одержання 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-7,8-дигідро-5Н-пірано[4,3- $\text{cl}_3$ -піримідину

До розчину 5г гідрохлориду (20ммоль) 6-бром-5-метилпіридин-2-карбоксамідину з прикладу 18.1 в 60мл метанолу додають 8,6г метилату натрію (30%-ий розчин в метанолі). Через 30хв. змішують з 4,7г (30ммоль) 3-диметиламінометилентетрагідропіран-4-она [для одержання, див. WO 2004/060890 і Journal of Heterocycl. Chem. 21 (5), 1441 (1984)] і перемішують 5 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після цього з реакційного розчину під вакуумом видаляють розчинник і залишок хроматографують через силікагель за допомогою циклогексан/простий метил-трет-бутиловий ефір (1:1) і простий метил-трет-бутиловий ефір. Одержують 1,4г сполуки, зазначеного в заголовку у вигляді жовтуватої твердого речовини.

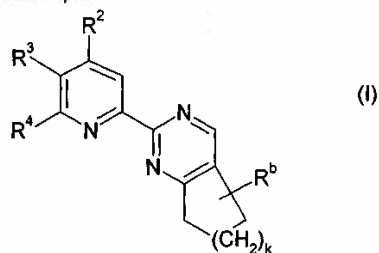
$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,5 (s); 3,1 (m); 4,1 (m); 4,7 (s); 7,65 (m); 8,35 (m) і 8,6 (s).

80.2 Одержання 2-[6-(2,3-дифторфеніл)-5-метил-піридин-2-іл]-7,8-дигідро-5Н-пірано[4,3- $\text{cl}_3$ -піримідину

До розчину 0,4г 2-(6-бром-5-метил-піридин-2-іл)-7,8-дигідро-5Н-пірано[4,3- $\text{cl}_3$ -піримідину з прикладу 80.1 в 20мл простого диметилового ефіру етиленгліколю додають по черзі 0,25г 2,3-дифторфенілборної кислоти і 0,41г карбонату натрію в 20мл води. Після додавання приблизно 30мг дихлориду [1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан]-палладію(II) перемішують 5 годин в колбі зі зворотнім холодильником. Після чого реакційний розчин розподіляють між водою і простим метил-трет-бутиловим ефіром. Органічні фази розділяють, розчинник видаляють під вакуумом і залишок хроматографують через силікагель за допомогою циклогексан/простий метил-трет-бутиловий ефір (1:1), причому одержують 0,25г сполуки, зазначеного в заголовку з точкою плавлення від 160 до 163°C.

Аналогічним чином одержують наведені в таблицях 1 і 2 сполуки I, а також сполуки I прикладів з 81 по 89.

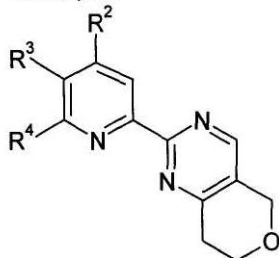
Таблиця 1:



Прикл.	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>b</sup>	k	Тпл. (°C)/ консистенція
1	3-фурил	CH <sub>3</sub>	H	H	1	194-198
2	тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	194-198
3	тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	163-167
4	3-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	108-112
5	4-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	197-199
6	5-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	132-137
7	5-хлор-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	162-164
8	4-метил-тіофен-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	171-174
9	5-ацетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	олія
10	5-метоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	188-195
11	піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	210-212
12	2-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	207-209
13	6-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	192-194
14	6-фтор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	139-143
15	6-метокси-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	165-167
16	піридин-4-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	183-185
17	піримідин-5-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	1	177
18	2-метоксипіридин-5-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	157-158
19	піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	165-168
20	піридин-4-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	197-201
21	2-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	183-186
22	6-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	170-173
23	6-фтор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	158-160
24	6-метокси-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	157-158
25	піримідин-5-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	159-162
26	3-фурил	CH <sub>3</sub>	H	H	2	156-158
27	тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	148-151
28	тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	145-148
29	3-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	олія
30	4-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	173-188
31	5-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	88-93
32	4-метил-тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	169-173
33	5-хлор-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	140-143
34	5-ацетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	197-199
35	5-метоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	156-166
36	5-етоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	115-119
37	5-п-гексоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	2	82-85

38	піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	148-151
39	піридин-4-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	198-200
40	піримідин-5-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	163-165
41	2-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	197-199
42	6-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	182-185
43	6-фтор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	157-159
44	6-метокси-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	134-137
45	3-фурил	CH <sub>3</sub>	H	H	3	144-147
46	тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	130-133
47	тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	156-158
48	3-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	олія
49	4-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	143-144
50	4-метил-тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	137-138
51	5-хлор-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	144-147
52	5-ацетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	176-177
53	5-метоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	168-171
54	5-етоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	131-133
55	5-п-гексоксиіміноетил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	H	3	72-75
56	піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	198
57	піридин-4-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	180-181
58	піримідин-5-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	192-193
59	2-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	214-215
60	6-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	201-206
61	6-фтор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	143-146
62	6-метокси-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	152-156
63	3-фурил	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	160-162
64	тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	145-146
65	тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	206
66	4-метил-тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	186-187
67	3-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2	олія

Таблиця 2:

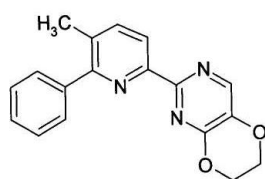


Прикл.	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	Тпл. (°C)
68	піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	141
69	піридин-4-іл	CH <sub>3</sub>	H	142
70	6-метокси-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	144
71	2-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	146

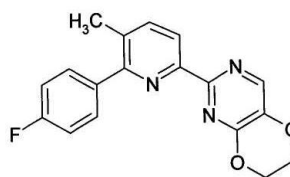
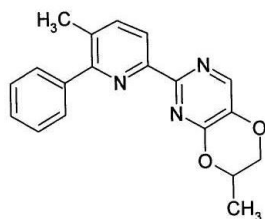


72	6-хлор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	147
73	3-фурил	CH <sub>3</sub>	H	148
74	тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	149
75	тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	150
76	4-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	151
77	6-фтор-піридин-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	153
78	4-метил-тієн-3-іл	CH <sub>3</sub>	H	154
79	3-метил-тієн-2-іл	CH <sub>3</sub>	H	168
80	2,3-дифторфеніл	CH <sub>3</sub>	H	160-163

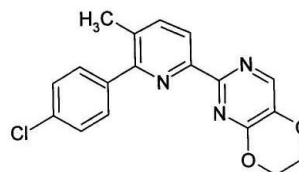
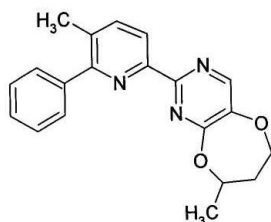
Приклад 81: Тпл. 177-188°C



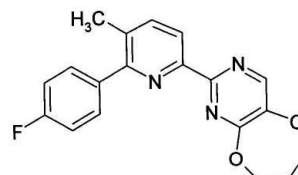
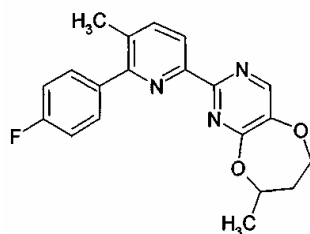
Приклад 82: Тпл. 195-197°C

Приклад 83: M+N<sup>+</sup>: 320,10

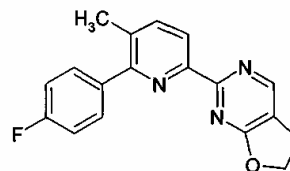
Приклад 84: Тпл. 187-199°C

Приклад 85: M+N<sup>+</sup>: 334,10

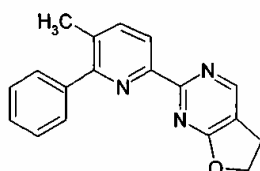
Приклад 86: Тпл. 167,3-169,3°C

Приклад 87: M+N<sup>+</sup>: 352,10

Приклад 88: Тпл. 173-178°C



Приклад 89: Тпл. 165-172°C



Перевірка фунгіцидної дії:

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

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

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

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн.част. діючих речовин з прикладів 1, 2, 3, 4, 5, 6, 8, 13, 14, 15, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 31, 32, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 41, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50 відповідно 52 показали максимальне ураження в 20%, в той час як необроблені рослини були уражені на 100%.

Приклад застосування 2 - Дія проти сітчастої плямистості ячменю, викликаной *Pyrenophora teres* при 1-денному захисному застосуванні

Листя вирощених в горщиках паростків ячменю обприскували до утворення крапель водною суспензією в наведеній нижче концентрації діючої речовини. Через 24 години після підсихання напρισканого шару дослідні рослини інокулювали водною суспензією спор *Pyrenophora* [син. *Drechslera*] *teres*, збудником сітчастої плямистості.

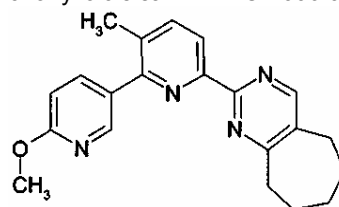
Потім дослідні рослини поміщали в теплицю при температурі від 20 до 24°C і відносній вологості повітря від 95 до 100%. Через 6 днів ступінь розвитку захворювання визначали візуально в % ураження загальної поверхні листя.

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн.част. діючих речовин з прикладів 1, 2, 3, 4, 6, 8, 12, 14, 15, 20, 23, 24, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 34, 35, 36, 38, 39, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 59, 60, 65 відповідно 67 показали максимальне ураження в 20%, в той час як необроблені рослини були уражені на 90%.

Приклад застосування 3 - Лікувальна дія проти бурї іржі пшениці, викликаной *Puccinia recondita*

Листя вирощених в горщиках сянців пшениці сорту "Kanzler" інокулювали суспензією спор бурї іржі (*Puccinia recondita*). Після цього горшки поміщали на 24 години в камеру з високою вологістю повітря (від 90 до 95 %) і з температурою від 20 до 22°C. В цей час спори проростали і паросткові трубочки проникали в тканину листя. Наступного дня інфіковані рослини обприскували до утворення крапель водною суспензією в зазначеній нижче концентрації. Після підсихання напρισканого шару дослідні рослини вирощували в теплиці протягом 7 днів при температурі від 20 до 22°C і відносній вологості повітря від 65 до 70%. Потім на листі визначали ступінь розвитку іржавних грибів.

В цьому тесті рослини, оброблені за допомогою 250млн.част. діючих речовин з прикладу 44 не показали ніякого ураження, в той час як необроблені рослини були уражені на 90%. Для порівняльних цілей рослини, оброблені при рівних умовах сполукою з заявки WO 2006/010570



показали ураження в 90%.