



УКРАЇНА

(19) UA (11) 81568 (13) C2

(51) МПК (2006)

C07C 237/42 (2006.01)

A01N 37/18

A01P 13/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ЗАМІЩЕНІ БЕНЗОЇЛОМ ФЕНІЛАЛАНІНАМІДИ, СПОСОБИ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ПРОМІЖНА СПОЛУКА,
ГЕРБИЦИДНИЙ ЗАСІБ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З НЕБАЖАНИМ РОСТОМ РОСЛИН

1

2

(21) а200608125

(22) 17.12.2004

(24) 10.01.2008

(86) РСТ/ЕР2004/014392, 17.12.2004

(31) 103 60 395.6

(32) 19.12.2003

(33) DE

(72) ВІТШЕЛЬ МАТТІАС, ПУЛЬ МІХАЕЛЬ,
ХАМПРЕХТ ГЕРХАРД, ПАРРА РАПАДО ЛІЛІАНА,
ES/DE, МІССЛІТЦ УЛЬФ, ЦАГАР СІРІЛЛ, ПЛАТ
ПЕТЕР, РАЙНХАРД РОБЕРТ, ЗІФЕРНІХ БЕРНД,
DE/DE, ЛІБЛЬ РЕКС, US/DE

(73) БАСФ АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ

(56) WO 03066576, A1, 14.08.2003

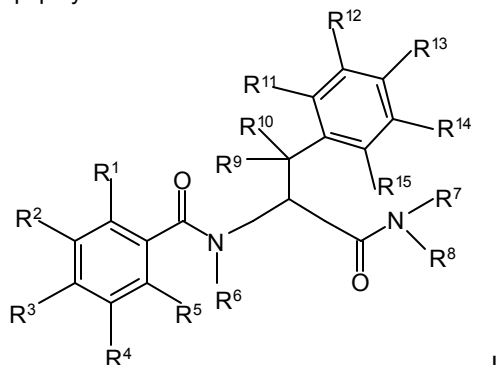
US 4 004 008, A, 18.01.1977

WO 9705865, A, 20.02.1997

GB 2 369 117, A, 22.05.2002

JP 3294253, A, 25.12.1991

JP 10298151, A, 10.11.1998

SOLOSHONOK V. A. et al. TETRAHEDRON:
ASYMMETRY, 1994, vol.5, no.6, p.1091-1094SOLOSHONOK V. A. et al. TETRAHEDRON
LETTERS, 1994, vol. 35, no.17, p.2713-2716GIANCARLO JOMMI et al. GAZZETTA CHIMICA
ITALIANA, 1994, 124(7), p.299-300SOLOSHONOK V. A. et al. J. ORG. CHEM., 1997,
62(11), p.3470-3479(57) 1. Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди
формули I

у якій змінні мають наступні значення:

R¹ означає галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-галогеналкокси, нітро, гідроксикарбоніл, C₁-C₆-галогеналкілтіо або феніл; R², R³, R⁴ та R⁵ означають водень, галоген, ціано, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкіламіно або C₁-C₆-алкілтіо;

R⁶, R⁷ означають водень, гідрокси;

R⁸ означає C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-галогеналкіл;

R⁹ означає OR¹⁶, SR¹⁷ або HNR¹⁸R¹⁹;

R¹⁰ означає водень або C₁-C₆-алкіл;

R¹¹, R¹² означають водень, галоген, ціано, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, гідрокси, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, гідрокси, нітро, гідроксi-C₁-C₄-алкіл, C₁-C₆-алкоксi-C₁-C₄-алкіл, три(C₁-C₆-алкіл)силілоксi-C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкілтіо, (гідроксикарбоніл)-C₁-C₆-алкіл, (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₁-C₆-алкіл, (гідроксикарбоніл)-C₂-C₆-алкеніл, (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₂-C₆-алкеніл, (гідроксикарбоніл)-C₁-C₄-алкоксi, (C₁-C₄-алкоксикарбоніл)-C₁-C₄-алкокси, (C₁-C₄-алкілкарбоніл)оксi-C₁-C₄-алкіл, гідроксикарбоніл-C₁-C₄-алкоксi-C₁-C₄-алкіл, (C₁-C₄-алкілсульфоніл)оксi-C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкіл-О-С(О)-[C₁-C₄-алкіл-О]₃-C₁-C₄-алкіл, карбамоїлоксi-C₁-C₄-алкіл, (C₁-C₄-алкіламінокарбоніл)оксi-C₁-C₄-алкіл, [ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл]оксi-C₁-C₄-алкіл, [(C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]оксi-C₁-C₄-алкіл, бензилокси, причому фенільне кільце може бути заміщене 1-3 залишками із групи, яка включає галоген та C₁-C₄-алкіл,

аміно, C₁-C₄-алкіламіно, ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно, C₁-C₄-алкілсульфоніламіно, C₁-C₄-галогеналкілсульфоніламіно, C₁-C₄-алкілкарбоніламіно, карбамоїламіно, (C₁-C₄-алкіламінокарбоніламіно, [ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно]карбоніламіно, [(C₁-C₄-галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]аміно, феніл або гетероциклі, причому фенільний та гетероциклічний залишок двох названих останніми замісників може мати від одного до трьох залишків із групи, яка включає: галоген, нітро, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, гідроксикарбоніл і C₁-C₆-алкоксикарбоніл;

(13) C2

(11) 81568

(19) UA

R^{13} , R^{14} та R^{15} означають водень, галоген, ціано, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галогеналкокси, гідрокси, нітро, C_1 - C_6 -алкілтіо або бензилокси;

R^{16} , R^{17} та R^{18} означають водень, C_1 - C_6 -алкіл, три(C_1 - C_6 -алкіл)силіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл, C_3 - C_6 -галогеналкеніл, C_3 - C_6 -галогеналкініл, форміл, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, C_3 - C_6 -циклоалкілкарбоніл, C_2 - C_6 -алкенілкарбоніл, C_2 - C_6 -алкінілкарбоніл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 -алкенілоксикарбоніл, C_3 - C_6 -алкінілоксикарбоніл, C_1 - C_6 -алкіламінокарбоніл, C_3 - C_6 -алкеніламінокарбоніл, C_3 - C_6 -алкініламінокарбоніл, C_1 - C_6 -алкілсульфоніламінокарбоніл, C_1 - C_6 -галогеналкілсульфоніламінокарбоніл, ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_3 - C_6 -алкеніл)-N-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_3 - C_6 -алкініл)-N-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_1 - C_6 -алкоксі)-N-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_3 - C_6 -алкеніл)-N-(C_1 - C_6 -алкоксі)-амінокарбоніл, N-(C_3 - C_6 -алкініл)-N-(C_1 - C_6 -алкоксі)-амінокарбоніл, ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінотіокарбоніл, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксіміно- C_1 - C_6 -алкіл, N-(C_1 - C_6 -алкіламіно)-іміно- C_1 - C_6 -алкіл або N-(ді- C_1 - C_6 -алкіламіно)-іміно- C_1 - C_6 -алкіл, причому названі алкільний, циклоалкільний та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, ді-(C_1 - C_4 -алкіл)-аміно, C_1 - C_4 -алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_4 -алкіламінокарбоніл, ді-(C_1 - C_4 -алкіл)-амінокарбоніл або C_1 - C_4 -алкілкарбонілокси; феніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, феноксикарбоніл, феніламінокарбоніл, фенілсульфоніламінокарбоніл, N-(C_1 - C_6 -алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл, феніл- C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, гетероциклі, гетероциклі- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклікарбоніл, гетероциклікарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклілоксикарбоніл, гетероцикліламінокарбоніл, гетероциклілсульфоніламінокарбоніл, N-(C_1 - C_6 -алкіл)-N-(гетероциклі)-амінокарбоніл або гетероциклі- C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, причому фенільний і гетероциклільний залишок сімнадцяти названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -галогеналкокси; SO_2R^{20} ; $-C(O)[C_1-C_4-алкіл-O]_3-C_1-C_4-алкіл$; або $-C(O)-O-C_1-C_4-алкіл-O-феніл$, причому фенільний залишок необов'язково може бути заміщений одним-трьма залишками із групи, яка включає галоген та C_1 - C_4 -алкіл; R^{19} означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл, C_3 - C_6 -галогеналкеніл, C_3 - C_6 -галогеналкініл, причому названі алкільні та циклоалкільні залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, ді-(C_1 - C_4 -алкіл)-аміно, C_1 -

C_4 -алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_4 -алкіламінокарбоніл, ді-(C_1 - C_4 -алкіл)-амінокарбоніл або C_1 - C_4 -алкілкарбонілокси; або феніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклі або гетероциклі- C_1 - C_6 -алкіл, причому фенільний і гетероциклільний залишок чотирьох названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -галогеналкокси;

R^{20} означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл або феніл, причому фенільний залишок може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл або C_1 - C_6 -алкокси; а також їх застосовні в сільському господарстві солі.

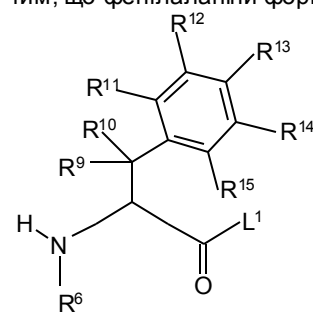
2. Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I за п. 1, причому R^1 означає галоген або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

3. Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I за п. 1 або 2, причому R^2 та R^3 незалежно один від одного означають водень, галоген або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

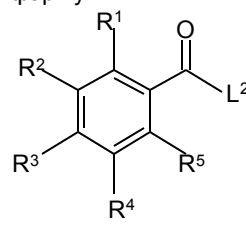
4. Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I за будь-яким з пп. 1-3, причому R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{13} , R^{14} та R^{15} означають водень.

5. Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I за будь-яким з пп. 1-4, причому R^9 означає OR^{16} .

6. Спосіб одержання заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, який відрізняється тим, що фенілаланіни формули V

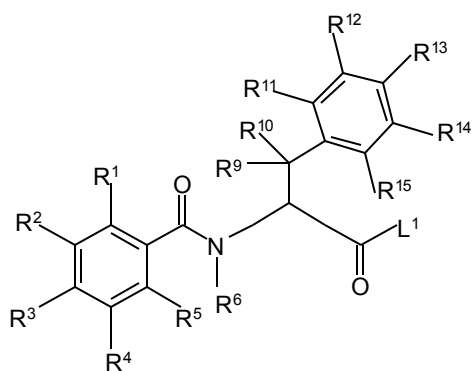


де R^6 та R^9 - R^{15} мають наведені в п. 1 значення та L^1 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється, вводять у взаємодію з бензойними кислотами, відповідно похідними бензойних кислот формули IV



де R^1 - R^5 мають наведені в п. 1 значення та L^2 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється,

з одержанням відповідних похідних бензоїлу формули III



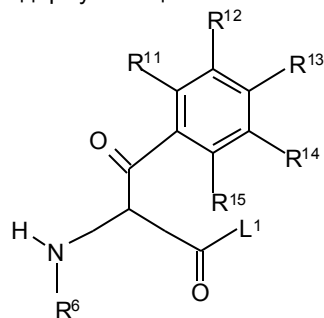
, III

де R^1 - R^6 та R^9 - R^{15} мають наведені в п. 1 значення та L^1 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється,

і на закінчення одержані похідні бензоїлу формули III вводять у взаємодію з аміном формули II HNR^7R^8 , II

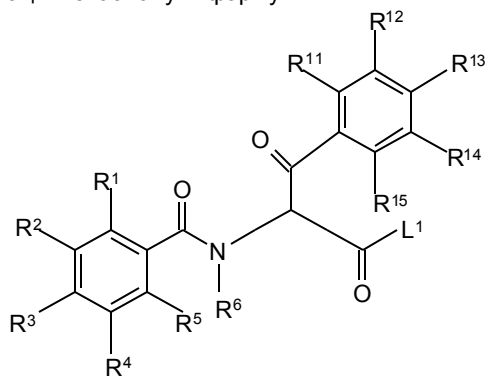
де R^7 та R^8 мають наведені в п. 1 значення.

7. Спосіб одержання заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I за п. 1, де R^9 означає гідрокси та R^{10} означає водень, який **відрізняється** тим, що похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси та R^{10} означає водень, одержують ацилюванням кетосполук формули XIII



, XIII

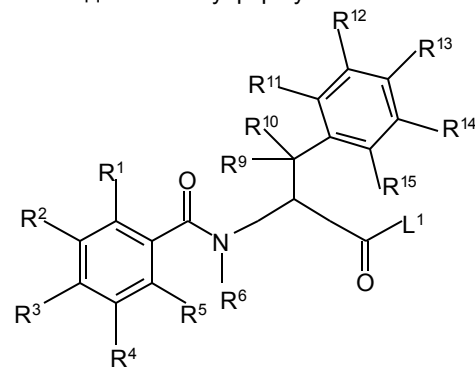
де R^6 , а також R^{11} - R^{15} мають наведені в п. 1 значення та L^1 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється, бензойною кислотою (похідними) формули IV в N-ацилкетосполуки формули XII



, XII

де R^1 - R^6 , а також R^{11} - R^{15} мають наведені в п. 1 значення та L^1 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється, і заключним відновленням кетогрупи.

8. Похідні бензоїлу формули III



, III

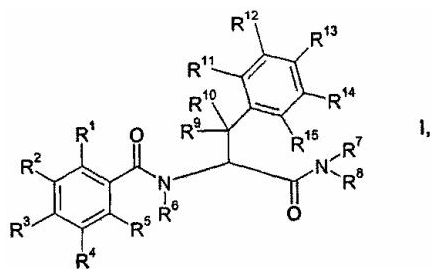
де R^1 - R^6 та R^9 - R^{15} мають наведені в п. 1 значення та L^1 означає відхідну групу, що нуклеофільно витісняється.

9. Засіб, який містить гербіцидно активну кількість принаймні одного заміщеного бензоїлом фенілаланінаміду формули I або застосовної в сільському господарстві солі сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 і звичайні для створення препаративної форми захисту рослин допоміжні засоби.

10. Спосіб одержання засобів за п. 9, який **відрізняється** тим, що змішують гербіцидно активну кількість принаймні одного заміщеного бензоїлом фенілаланінаміду формули I або застосовної в сільському господарстві солі сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 і звичайні для створення препаративної форми захисту рослин допоміжні засоби.

11. Спосіб боротьби з небажаним ростом рослин, який **відрізняється** тим, що гербіцидно активною кількістю принаймні одного заміщеного бензоїлом фенілаланінаміду формули I або застосовної в сільському господарстві солі сполуки формули I будь-яким з пп. 1-5 впливають на рослини, їх простір виростання і/або на насіння.

12. Застосування заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I та застосовних у сільському господарстві солей за будь-яким з пп. 1-5 як гербіцидів.



у якій змінні мають наступні значення:

R^1 означає галоген, ціано, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_1 - C_6 -галогеналкокси, нітро, гідроксикарбоніл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 -галогеналкілтіо або феніл;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 означають водень, галоген, ціано, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галогеналкокси, нітро, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, ді- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-аміно, C_1 - C_6 -алкілтіо або C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл;

R^6 , R^7 означають водень, гідроксі або C_1 - C_6 -алкокси;

R^8 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -ціаноалкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл;

R^9 означає OR^{16} , SR^{17} або $NR^{18}R^{19}$;

R^{10} означає водень або C_1 - C_6 -алкіл;

R^{11} , R^{12} означають водень, галоген, ціано, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл,

гідроксі, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галогеналкокси, гідроксі- C_1 - C_4 -алкіл, нітро, гідроксі- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл, три- $(C_1$ - C_6 -алкіл)силілокси- C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -алкілтіо, (гідроксикарбоніл)- C_1 - C_6 -алкіл, (C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл)- C_1 - C_6 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_2 - C_6 -алкеніл, (C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл)- C_2 - C_6 -алкеніл, (гідроксикарбоніл)- C_1 - C_4 -алкокси, (C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1 - C_4 -алкокси, (C_1 - C_4 -алкілкарбоніл)оксі- C_1 - C_4 -алкіл, гідроксикарбоніл- C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл, (C_1 - C_4 -алкілсульфоніл)оксі- C_1 - C_4 -алкіл,

C_1 - C_4 -алкіл- O - $C(O)$ - $[C_1$ - C_4 -алкіл- $O]$ - C_1 - C_4 -алкіл, карбамоїлокси- C_1 - C_4 -алкіл, (C_1 - C_4 -алкіламінокарбоніл)оксі- C_1 - C_4 -алкіл, [ді- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-амінокарбоніл]оксі- C_1 - C_4 -алкіл, [(C_1 - C_4 -галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]оксі- C_1 - C_4 -алкіл, бензилокси, причому фенільне кільце може бути заміщене 1-3 залишками із групи, яка включає галоген і C_1 - C_4 -алкіл,

аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, ди- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-аміно, C_1 - C_4 -алкілсульфоніламіно, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфоніламіно, C_1 - C_4 -алкілкарбоніламіно, карбамоїламіно, (C_1 - C_4 -алкіламіно)карбоніламіно, [ді- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-аміно]карбоніламіно, [(C_1 - C_4 -галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]аміно, феніл або гетероциклілі, причому фенільний і гетероциклілі залишок двох названих останніми замісників може мати від одного до трьох залишків із групи, яка включає: галоген, нітро, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, гідроксикарбоніл і C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл;

R^{13} , R^{14} , R^{15} означає водень, галоген, ціано, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галогеналкокси, гідрокси, нітро, C_1 - C_6 -алкілтіо або бензилокси;

R^{16} , R^{17} , R^{18} означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, три- $(C_1$ - C_6 -алкіл)силіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл, C_3 - C_6 -галогеналкеніл, C_3 - C_6 -галогеналкініл, форміл, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, C_3 - C_6 -циклоалкілкарбоніл, C_2 - C_6 -алкенілкарбоніл, C_2 - C_6 -алкінілкарбоніл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 -алкенілоксикарбоніл, C_3 - C_6 -алкінілоксикарбоніл, C_1 - C_6 -алкіламінокарбоніл, C_3 - C_6 -алкеніламінокарбоніл, C_3 - C_6 -алкініламінокарбоніл, C_1 - C_6 -алкілсульфоніламінокарбоніл, C_1 - C_6 -галогеналкілсульфоніламінокарбоніл, ді- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N- $(C_3$ - C_6 -алкеніл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N- $(C_3$ - C_6 -алкініл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N- $(C_1$ - C_6 -алкокси)-N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N- $(C_3$ - C_6 -алкеніл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкокси)-амінокарбоніл, N- $(C_3$ - C_6 -алкініл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкокси)-амінокарбоніл, ді- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксііміно- C_1 - C_6 -алкіл, N- $(C_1$ - C_6 -алкіламіно)-іміно- C_1 - C_6 -алкіл або N- $(C_1$ - C_6 -алкіламіно)-іміно- C_1 - C_6 -алкіл,

причому названі алкільний, циклоалкільний та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, ді- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-аміно, C_1 - C_4 -алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_4 -алкіламінокарбоніл, ді- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-амінокарбоніл або C_1 - C_4 -алкілкарбонілокси;

феніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, феноксикарбоніл, феніламінокарбоніл, фенілсульфоніламінокарбоніл, N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, феніл- C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, гетероциклілі, гетероциклілі- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклілоксикарбоніл, гетероцикліламінокарбоніл, гетероциклілсульфоніламінокарбоніл, N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-N- $(C_1$ - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл або гетероциклілі- C_1 - C_6 -алкілкарбоніл,

причому фенільний і гетероциклільний залишок сімнадцяти названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -галогеналкокси;

SO_2R^{20} ,

- $C(O)$ - $[C_1$ - C_4 -алкіл- $O]$ - C_1 - C_4 -алкіл; або

- $C(CO)$ - C_1 - C_4 -алкіл- O -феніл, причому фенільний залишок необов'язково може бути заміщений одним-трьма залишками із групи, яка включає галоген та C_1 - C_4 -алкіл;

R^{19} означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл, C_3 - C_6 -галогеналкеніл, C_3 - C_6 -галогеналкініл,

причому названі алкільні та циклоалкільні залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, ді- $(C_1$ - C_4 -алкіл)-аміно, C_1 - C_4 -алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_4 -

алкіламінокарбоніл, ді-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл або С₁-С₄-алкілкарбонілоксид; або

феніл, феніл-С₁-С₆-алкіл, гетероцикліл або гетероцикліл-С₁-С₆-алкіл,

причому фенільний і гетероциклільний залишок чотирьох названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-алкоксид або С₁-С₄-галогеналкоксид;

R²⁰ означає С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл або феніл,

причому фенільний залишок може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл або С₁-С₆-алкоксид;

а також їх застосовних у сільському господарстві солей.

Крім того, винахід стосується способу та проміжних продуктів для одержання сполук формули I, засобів, які містять ці сполуки, а також застосування цих сполук та засобів, як їх містять, для боротьби зі шкідливими рослинами.

З літературних джерел, наприклад, з [WO 03/066576], відомі гербіцидно активні похідні феніланіну, які заміщені в β-положенні або можуть мати необов'язково заміщені галогеном алкільні, алкенільні або алкінільні залишки.

Заміщені бензоїлом амінокислотні амідни з фармацевтичною активністю описуються, серед іншого, в [WO 97/05865, GB 2369117, JP 10/298151 та JP 03/294253].

Гербіцидні властивості відомих на цей час сполук, відповідно, переносність культурними рослинами можуть задовольняти тільки умовно. В основу даного винаходу тому покладено завдання розробки нових, зокрема гербіцидно активних, сполук з поліпшеними властивостями.

Відповідно до цього були розроблені гетероарил-заміщені феніланінаміди формули I, а також їх гербіцидна активність.

Далі були розроблені гербіцидні засоби, які містять сполуки I і мають дуже гарну гербіцидну дію. Крім того, був розроблений спосіб одержання цих засобів і спосіб боротьби з небажаними рослинами за допомогою сполук формули I.

Сполуки формули I містять залежно від типу заміщення два або декілька центрів хіральності і існують у вигляді енантіомерів або сумішей діастереомерів. Об'єктом винаходу є як чисті енантіомери або діастереомери, так і їх суміші.

Сполуки формули I можуть також знаходитися і у формі своїх застосовних у сільському господарстві солей, причому тип солі, як правило, не відіграє ролі. Загалом придатні солі тих катіонів або кислот-адитивні солі тих кислот, катіони, відповідно, аніони яких негативного не впливають на гербіцидну активність сполук I.

Зокрема, придатні як катіони іони лужних металів, переважно, натрію, літію та калію, лужноземельних металів, краще, кальцію та магнію, і перехідних металів, краще, марганцю, міді, цинку та заліза, а також амонію, причому тут, за бажанням, від одного до чотирьох атомів водню можуть бути замінені С₁-С₄-алкілом, гідроксид-С₁-С₄-

алкілом, С₁-С₄-алкоксид-С₁-С₄-алкілом, гідроксид-С₁-С₄-алкоксид-С₁-С₄-алкілом, фенілом або бензилом, краще, амоній, диметиламоній, діізопропіламоній, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, 2-(2-гідроксидет-1-оксидет-1-іламоній, ді-(2-гідроксидет-1-іл)амоній, триметилбензиламоній, далі іони фосфонію, іони сульфонію, краще три-(С₁-С₄-алкіл)сульфоній та іони сульфоксонію, краще, три-(С₁-С₄-алкіл)сульфоксоній.

Аніонами застосовних кислот-адитивних солей є, насамперед, хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідрофосфат, гідрофосфат, нітрат, гідрокарбонат, карбонат, гексафторосілікат, гексафторофосфат, бензоат, а також аніони С₁-С₄-алканових кислот, краще, форміат, ацетат, пропіонат та бутират.

Названі для замісників R¹-R²⁰ або як залишки фенільного або гетероциклільного кільця органічні молекули являють собою збірні поняття для індивідуального перерахування окремих членів груп. Всі вуглеводневі ланцюги, тобто всі алкіл-, алкеніл-, алкініл-, ціаноалкіл-, галогеналкіл-, галогеналкеніл-, галогеналкініл-, алкокси-, галогеналкокси-, алкоксилалкіл-, алкілкарбоніл-, алкенілкарбоніл-, алкінілкарбоніл-, алкоксикарбоніл-, алкенілоксикарбоніл-, алкінілоксикарбоніл-, алкіламіно-, алкіламінокарбоніл-, алкеніламінокарбоніл-, алкініламінокарбоніл-, алкілсульфоніламінокарбоніл-, діалкіламінокарбоніл-, алкіламінокарбоніл-, алкіламінокарбоніл-, алкіламінокарбоніл-, алкоксіамінокарбоніл-, алкоксіамінокарбоніл-, діалкіламінокарбоніл-, алкілкарбонілакіл-, алкоксіміноалкіл-, N-(алкіламіно)-іміноалкіл-, N-(діалкіламіно)-іміноалкіл-, фенілакіл-, фенілкарбонілакіл-, N-алкіл-N-феніламінокарбоніл-, фенілакілкарбоніл-, гетероциклілакіл-, гетероциклілкарбонілакіл-, N-алкіл-N-гетероцикліламінокарбоніл-, гетероциклілакілкарбоніл-, алкілтіо- та алкілкарбонілокси-фрагменти можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими.

Якщо не зазначено інше, галогеновані замісники мають бажано від одного до п'яти однакових або різних атомів галогену. Значення галоген являє собою фтор, хлор, бром або йод.

Далі є, наприклад, наступні значення:

- С₁-С₄-алкіл, а також алкільні залишки С₁-С₆-алкілімінооксид-С₁-С₆-алкілу, гідроксид(С₁-С₄-алкілу), три(С₁-С₄-алкіл)силілоксид-С₁-С₄-алкілу, (С₁-С₄-алкілкарбоніл)оксид-С₁-С₄-алкілу, гідроксикарбоніл-С₁-С₄-алкоксид-С₁-С₄-алкілу, (С₁-С₄-алкілсульфоніл)оксид-С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-алкіл-О-С(О)-[С₁-С₄-алкіл-О-]₃-С₁-С₄-алкілу, карбамоїлоксид-С₁-С₄-алкілу, (С₁-С₄-алкіламінокарбоніл)оксид-С₁-С₄-алкілу, [ді-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл]оксид-С₁-С₄-алкілу, [(С₁-С₄-галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]оксид-С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-алкілсульфоніламіно-, -С(О)-[С₁-С₄-алкіл-О-]₃-С₁-С₄-алкілу, -С(О)-О-С₁-С₄-алкіл-О-фенілу означають, наприклад, метил, етил, n-пропіл, 1-

метилетил, н-бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл та 1,1-диметилетил;

- C₁-C₆-алкіл, а також алкільні залишки C₁-C₆-алкілсульфоніламінокарбонілу, N-(C₃-C₆-алкеніл)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбонілу, (C₃-C₆-алкініл)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбонілу, N-(C₁-C₆-алкоксі)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбонілу, C₁-C₆-алкілкарбоніл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкоксіміно-C₁-C₆-алкілу, N-(C₁-C₆-алкіламіно)-іміно-C₁-C₆-алкілу, N-(ді-C₁-C₆-алкіламіно)-іміно-C₁-C₆-алкілу, феніл-C₁-C₆-алкілу, фенілкарбоніл-C₁-C₆-алкілу, N-(C₁-C₆-алкіл)-N-феніламінокарбонілу, гетероцикліл-C₁-C₆-алкілу, гетероциклілкарбоніл-C₁-C₆-алкілу, N-(C₁-C₆-алкіл)-N-гетероцикліламінокарбонілу, три(C₁-C₆-алкіл)силілокси-C₁-C₄-алкілу, три(C₁-C₆-алкіл)силілу, (гідроксикарбоніл)-C₁-C₆-алкілу, (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₁-C₆-алкілу означають C₁-C₄-алкіл, наведений вище, а також, наприклад, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, н-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-етил-1-метилпропіл та 1-етил-3-метилпропіл;

C₁-C₄-алкілкарбоніл, а також алкілкарбонільні частини (C₁-C₄-алкілкарбоніл)оксі, (C₁-C₄-алкілкарбоніл)оксі-C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-алкілкарбоніламіно означають, наприклад, метилкарбоніл, етилкарбоніл, пропілкарбоніл, 1-метилетилкарбоніл, бутилкарбоніл, 1-метилпропілкарбоніл, 2-метилпропілкарбоніл або 1,1-диметилетилкарбоніл;

- C₁-C₆-алкілкарбоніл, а також алкілкарбонільні залишки C₁-C₆-алкілкарбоніл-C₁-C₆-алкілу, феніл-C₁-C₆-алкілкарбонілу та гетероцикліл-C₁-C₆-алкілкарбонілу означають C₁-C₄-алкілкарбоніл, як наведено вище, а також, наприклад, пентилкарбоніл, 1-метилбутилкарбоніл, 2-метилбутилкарбоніл, 3-метилбутилкарбоніл, 2,2-диметилпропілкарбоніл, 1-етилпропілкарбоніл, гексилкарбоніл, 1,1-диметилпропілкарбоніл, 1,2-диметилпропілкарбоніл, 1-метилпентилкарбоніл, 2-метилпентилкарбоніл, 3-метилпентилкарбоніл, 4-метилпентилкарбоніл, 1,1-диметилбутилкарбоніл, 1,2-диметилбутилкарбоніл, 1,3-диметилбутилкарбоніл, 2,2-диметилбутилкарбоніл, 2,3-диметилбутилкарбоніл, 3,3-диметилбутилкарбоніл, 1-етилбутилкарбоніл, 2-етилбутилкарбоніл, 1,1,2-триметилпропілкарбоніл, 1,2,2-триметилпропілкарбоніл, 1-етил-1-метилпропілкарбоніл або 1-етил-2-метилпропілкарбоніл;

- C₃-C₆-циклоалкіл, а також циклоалкільні частини C₃-C₆-циклоалкілкарбонілу означають моноциклічний, насичений вуглеводень з 3-6 членами кільця, такий, як циклопропіл, циклобутил, циклопентил та циклогексил;

- C₃-C₆-алкеніл, а також алкенільні частини C₃-C₆-алкенілоксикарбонілу, C₃-C₆-алкеніламінокарбонілу, N-(C₃-C₆-алкеніл)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбонілу та N-(C₃-C₆-алкеніл)-N-(C₁-C₆-алкоксі)-амінокарбонілу означають, наприклад, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл;

- C₂-C₆-алкеніл, а також алкенільні частини C₂-C₆-алкенілкарбонілу, (гідроксикарбоніл)-C₂-C₆-алкенілу, (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₂-C₆-алкенілу означають C₂-C₆-алкеніл, як наведено вище, а також етеніл;

- C₃-C₆-алкініл, а також алкінільні частини C₃-C₆-алкінілоксикарбонілу, C₃-C₆-алкініламінокарбонілу, N-(C₃-C₆-алкініл)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбонілу, N-(C₃-C₆-алкініл)-N-(C₁-C₆-алкоксі)-амінокарбонілу означають, наприклад, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1,2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-бутиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-2-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл та 1-етил-1-метил-2-пропініл;

- C₂-C₆-алкініл, а також алкінільні частини C₂-C₆-алкінілкарбонілу означають C₂-C₆-алкініл, як наведено вище, а також етиніл;

- C₁-C₄-ціаноалкіл означає, наприклад, ціанометил, 1-ціаноет-1-ил, 2-ціаноет-1-ил, 1-

ціанопрор-1-іл, 2-ціанопрор-1-іл, 3-ціанопрор-1-іл, 1-ціанопрор-2-іл, 2-ціанопрор-2-іл, 1-ціанобут-1-іл, 2-ціанобут-1-іл, 2-ціанобут-1-іл, 4-ціанобут-1-іл, 1-ціанобут-2-іл, 2-ціанобут-2-іл, 1-ціанобут-3-іл, 2-ціанобут-3-іл, 1-ціано-2-метилпрор-3-іл, 2-ціано-2-метилпрор-3-іл, 3-ціано-2-метилпрор-3-іл та 2-ціанометилпрор-2-іл;

- С₁-С₄-галогеналкіл, а також галогеналкільні залишки [(С₁-С₄-галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]оксі-С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галогеналкілсульфоніламіно, [(С₁-С₄-галогеналкілсульфоніл)-амінокарбоніл]аміно означають С₁-С₄-алкільний залишок, наведений вище, що частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, тобто, наприклад, хлорметил, дишлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дишлорфторметил, хлордифторметил, бромметил, йодметил, 2-фторетил, 2-хлоретил, 2-бромметил, 2-йодетил, 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, 2-фторпропіл, 3-фторпропіл, 2,2-дифторпропіл, 2,3-дифторпропіл, 2-хлорпропіл, 3-хлорпропіл, 2,3-дихлорпропіл, 2-бромпропіл, 3-бромпропіл, 3,3,3-трифторпропіл, 3,3,3-трихлорпропіл, 2,2,3,3,3-пентафторпропіл, гептафторпропіл, 1-(фторметил)-2-фторетил, 1-(хлорметил)-2-хлоретил, 1-(бромметил)-2-бромметил, 4-фторбутил, 4-хлорбутил, 4-бромбутил та нонафторбутил;

- С₁-С₆-галогеналкіл, а також галогеналкільні залишки С₁-С₆-галогеналкілсульфоніламінокарбонілу, С₁-С₆-галогеналкілію означають С₁-С₄-галогеналкіл, наведений вище, а також, наприклад 5-фторпентил, 5-хлорпентил, 5-бромпентил, 5-йодпентил, ундекафторпентил, 6-фторгексил, 6-хлоргексил, 6-бромгексил, 6-йодгексил та додекафторгексил;

- С₃-С₆-галогеналкеніл означає С₃-С₆-алкенільний залишок, наведений вище, який частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, наприклад, 2-хлорпроп-2-ен-1-іл, 3-хлорпроп-2-ен-1-іл, 2,3-дихлорпроп-2-ен-1-іл, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-іл, 2,3,3-трихлор-2-ен-1-іл, 2,3-дихлорбут-2-ен-1-іл, 2-бромпроп-2-ен-1-іл, 3-бромпроп-2-ен-1-іл, 2,3-дибромпроп-2-ен-1-іл, 3,3-дибромпроп-2-ен-1-іл, 2,3,3-трибром-2-ен-1-іл або 2,3-дибромбут-2-ен-1-іл;

- С₃-С₆-галогеналкініл означає С₃-С₆-алкінільний залишок, наведений вище, що частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, наприклад, 1,1-дифторпроп-2-ін-1-іл, 3-йодпроп-2-ін-1-іл, 4-фторбут-2-ін-1-іл, 4-хлорбут-2-ін-1-іл, 1,1-дифторбут-2-ін-1-іл, 4-йодбут-3-ін-1-іл, 5-фторпент-3-ін-1-іл, 5-йодпент-4-ін-1-іл, 6-фторгекс-4-ін-1-іл або 6-фторгекс-5-ін-1-іл;

- С₁-С₄-алкокси, а також алкокси-частини (С₁-С₄-алкоксикарбоніл)-С₁-С₄-алкокси, гідроксикарбоніл-С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкілу, (гідроксикарбоніл)-С₁-С₄-алкокси означають, наприклад, наприклад, метокси, етокси, пропокси,

1-метилетокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси та 1,1-диметилетокси;

- С₁-С₆-алкокси, а також алкокси-частини N-(С₁-С₆-алкокси)-N-(С₁-С₆-алкіл)-амінокарбонілу, N-(С₃-С₆-алкеніл)-N-(С₁-С₆-алкокси)-амінокарбонілу, N-(С₃-С₆-алкініл)-N-(С₁-С₆-алкокси)-амінокарбонілу та С₁-С₆-алкоксиіміно-С₁-С₆-алкілу означають С₁-С₄-алкокси, наведений вище, а також, наприклад, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метоксибутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-етилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-етилбутокси, 2-етилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-етил-1-метилпропокси та 1-етил-2-метилпропокси;

- С₁-С₄-галогеналкокси означає С₁-С₄-алкокси залишок, наведений вище, що частково або повністю заміщений фтором, хлором, бромом і/або йодом, а саме, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлордифторметокси, бромдифторметокси, 2-фторетокси, 2-хлоретокси, 2-бромметокси, 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, пентафторетокси, 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2-бромпропокси, 3-бромпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси, 2,2,3,3,3-пентафторпропокси, гептафторпропокси, 1-(фторметил)-2-фторетокси, 1-(хлорметил)-2-хлоретокси, 1-(бромметил)-2-брометокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси та нонафторбутокси,

- С₁-С₆-галогеналкокси означає С₁-С₄-галогеналкокси, наведений вище, а також, наприклад, 5-фторпентокси, 5-хлорпентокси, 5-бромпентокси, 5-йодпентокси, ундекафторпентокси, 6-фторгексокси, 6-хлоргексокси, 6-бромгексокси, 6-йодгексокси та додекафторгексокси;

- С₁-С₆-алкокси-С₁-С₄-алкіл означає заміщений С₁-С₆-алкокси, наведеним вище, С₁-С₄-алкіл, тобто, наприклад, метоксиметил, етоксиметил, пропоксиметил, (1-метилетокси)метил, бутоксиметил, (1-метилпропокси)метил, (2-метилпропокси)метил, (1,1-диметилетокси)метил, 2-(метокси)етил, 2-(етокси)етил, 2-(пропокси)етил, 2-(1-метилетокси)етил, 2-(бутокси)етил, 2-(1-метилпропокси)етил, 2-(2-метилпропокси)етил, 2-(1,1-диметилетокси)етил, 2-(метокси)пропіл, 2-(етокси)пропіл, 2-(пропокси)пропіл, 2-(1-метилетокси)пропіл, 2-(бутокси)пропіл, 2-(1-метилпропокси)пропіл, 2-(2-метилпропокси)пропіл, 2-(1,1-диметилетокси)пропіл, 3-(метокси)пропіл, 3-(етокси)пропіл, 3-(пропокси)пропіл, 3-(1-метилетокси)пропіл, 3-(бутокси)пропіл, 3-(1-метилпропокси)пропіл, 3-(2-метилпропокси)пропіл, 3-(1,1-диметилетокси)пропіл, 2-(метокси)бутил, 2-(етокси)бутил, 2-(пропокси)бутил, 2-(1-

метилетокси)бутил, 2-(бутоксид)бутил, 2-(1-метилпропокси)бутил, 2-(2-метилпропокси)бутил, 2-(1,1-диметилетокси)бутил, 3-(метокси)бутил, 3-(етокси)бутил, 3-(пропокси)бутил, 3-(1-метилетокси)бутил, 3-(бутоксид)бутил, 3-(1-метилпропокси)бутил, 3-(2-метилпропокси)бутил, 3-(1,1-диметилетокси)бутил, 4-(метокси)бутил, 4-(етокси)бутил, 4-(пропокси)бутил, 4-(1-метилетокси)бутил, 4-(бутоксид)бутил, 4-(1-метилпропокси)бутил, 4-(2-метилпропокси)бутил та 4-(1,1-диметилетокси)бутил;

- C₁-C₄-алкоксикарбоніл, а також алкоксикарбонільні частини C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкоксикарбонілу, ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно-C₁-C₄-алкоксикарбонілу, (C₁-C₄-алкоксикарбоніл)-C₁-C₄-алкокси означають, наприклад, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, пропоксикарбоніл, 1-метилетоксикарбоніл, бутоксикарбоніл, 1-метилпропоксикарбоніл, 2-метилпропоксикарбоніл або 1,1-диметилетоксикарбоніл;

- C₁-C₆-алкоксикарбоніл, а також алкоксикарбонільні частини (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₁-C₆-алкілу, (C₁-C₆-алкоксикарбоніл)-C₂-C₆-алкенілу означають C₁-C₄-алкоксикарбоніл, наведений вище, а також, наприклад, пентоксикарбоніл, 1-метилбутоксикарбоніл, 2-метилбутоксикарбоніл, 3-метилбутоксикарбоніл, 2,2-диметилпропоксикарбоніл, 1-етилпропоксикарбоніл, гексоксикарбоніл, 1,1-диметилпропоксикарбоніл, 1,2-диметилпропоксикарбоніл, 1-метилпентоксикарбоніл, 2-метилпентоксикарбоніл, 3-метилпентоксикарбоніл, 4-метилпентоксикарбоніл, 1,1-диметилбутоксикарбоніл, 1,2-диметилбутоксикарбоніл, 1,3-диметилбутоксикарбоніл, 2,2-диметилбутоксикарбоніл, 2,3-диметилбутоксикарбоніл, 3,3-диметилбутоксикарбоніл, 1-етилбутоксикарбоніл, 2-етилбутоксикарбоніл, 1,1,2-триметилпропоксикарбоніл, 1,2,2-триметилпропоксикарбоніл, 1-етил-1-метилпропоксикарбоніл або 1-етил-2-метилпропоксикарбоніл;

- C₁-C₄-алкілтіо означає, наприклад, метилтіо, етилтіо, пропілтіо, 1-метилетилтіо, бутилтіо, 1-метилпропілтіо, 2-метилпропілтіо та 1,1-диметилетилтіо;

- C₁-C₆-алкілтіо означає C₁-C₄-алкілтіо, наведений вище, а також, наприклад, пентилтіо, 1-метилбутилтіо, 2-метилбутилтіо, 3-метилбутилтіо, 2,2-диметилпропілтіо, 1-етилпропілтіо, гексилтіо, 1,1-диметилпропілтіо, 1,2-диметилпропілтіо, 1-метилпентилтіо, 2-метилпентилтіо, 3-метилпентилтіо, 4-метилпентилтіо, 1,1-диметилбутилтіо, 1,2-диметилбутилтіо, 1,3-диметилбутилтіо, 2,2-диметилбутилтіо, 2,3-диметилбутилтіо, 3,3-диметилбутилтіо, 1-етилбутилтіо, 2-етилбутилтіо, 1,1,2-триметилпропілтіо, 1,2,2-триметилпропілтіо, 1-етил-1-метилпропілтіо та 1-етил-2-метилпропілтіо;

- C₁-C₆-алкіламіно, а також алкіламіно залишки N-(C₁-C₆-алкіламіно)-іміно-C₁-C₆-алкілу означають,

наприклад, метиламіно, етиламіно, пропіламіно, 1-метилетиламіно, бутиламіно, 1-метилпропіламіно, 2-метилпропіламіно, 1,1-диметилетиламіно, пентиламіно, 1-метилбутиламіно, 2-метилбутиламіно, 3-метилбутиламіно, 2,2-диметилпропіламіно, 1-етилпропіламіно, гексиламіно, 1,1-диметилпропіламіно, 1,2-диметилпропіламіно, 1-метилпентиламіно, 2-метилпентиламіно, 3-метилпентиламіно, 4-метилпентиламіно, 1,1-диметилбутиламіно, 1,2-диметилбутиламіно, 1,3-диметилбутиламіно, 2,2-диметилбутиламіно, 2,3-диметилбутиламіно, 3,3-диметилбутиламіно, 1-етилбутиламіно, 2-етилбутиламіно, 1,1,2-триметилпропіламіно, 1,2,2-триметилпропіламіно, 1-етил-1-метилпропіламіно або 1-етил-2-метилпропіламіно;

- ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно означає, наприклад, N,N-диметиламіно, N,N-діетиламіно, N,N-дипропіламіно, N,N-ди-(1-метилетил)-аміно, N,N-дибутиламіно, N,N-ди-(1-метилпропіл)-аміно, N,N-ди-(2-метилпропіл)-аміно, N,N-ди-(1,1-диметилетил)-аміно, N-етил-N-метиламіно, N-метил-N-пропіламіно, N-метил-N-(1-метилетил)-аміно, N-бутил-N-метиламіно, N-метил-N-(1-метилпропіл)-аміно, N-метил-N-(2-метилпропіл)-аміно, N-(1,1-диметилетил)-N-метиламіно, N-етил-N-пропіламіно, N-етил-N-(1-метилетил)-аміно, N-бутил-N-етиламіно, N-етил-N-(1-метилпропіл)-аміно, N-етил-N-(2-метилпропіл)-аміно, N-етил-N-(1,1-диметилетил)-аміно, N-(1-метилетил)-N-пропіламіно, N-бутил-N-пропіламіно, N-(1-метилпропіл)-N-протламіно, N-(2-метилпропіл)-N-пропіламіно, N-(1,1-диметилетил)-N-пропіламіно, N-бутил-N-(1-метилетил)-аміно, N-(1-метилетил)-N-(1-метилпропіл)-аміно, N-(1-метилетил)-N-(2-метилпропіл)-аміно, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилетил)-аміно, N-бутил-N-(1-метилпропіл)-аміно, N-бутил-N-(2-метилпропіл)-аміно, N-бутил-N-(1,1-диметилетил)-аміно, N-(1-метилпропіл)-N-(2-метилпропіл)-аміно, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилпропіл)-аміно та N-(1,1-диметилетил)-N-(2-метилпропіл)-аміно;

- ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно, а також діалкіламіно залишки N-(ді-C₁-C₆-алкіламіно)-іміно-C₁-C₆-алкілу означають ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно, наведений вище, а також, наприклад, N,N-дипентиламіно, N,N-дигексиламіно, N-метил-N-пентиламіно, N-етил-N-пентиламіно, N-метил-N-гексиламіно та N-етил-N-гексиламіно;

- (C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, а також (алкіламіно)карбонільні частини (C₁-C₄-алкіламінокарбоніл)оксі-C₁-C₄-алкілу, (C₁-C₄-алкіламіно)карбоніламіно означають, наприклад, метиламінокарбоніл, етиламінокарбоніл, пропіламінокарбоніл, 1-метилетиламінокарбоніл, бутиламінокарбоніл, 1-метилпропіламінокарбоніл, 2-метилпропіламінокарбоніл або 1,1-диметилетиламінокарбоніл;

- ді-(C₁-C₄)алкіламінокарбоніл, а також ді-(C₁-C₄)алкіламінокарбонільні частини [ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл]оксі-C₁-C₄-алкілу, [ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно]карбоніламіно означають, наприклад, N,N-диметиламінокарбоніл, N,N-діетиламінокарбоніл, N,N-ді-(1-метилетил)-амінокарбоніл, N,N-дипропіламінокарбоніл, N,N-

амініотіокарбоніл, N-бутил-N-етиламініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,1-диметилетил)-амініотіокарбоніл, N-(1-метилетил)-N-пропіламініотіокарбоніл, N-бутил-N-пропіламініотіокарбоніл, N-(1-метилпропіл)-N-пропіламініотіокарбоніл, N-(2-метилпропіл)-N-пропіламініотіокарбоніл, N-(1,1-диметилетил)-N-пропіламініотіокарбоніл, N-бутил-N-(1-метилетил)-амініотіокарбоніл, N-(1-метилетил)-N-(1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-(1-метилетил)-N-(2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилетил)-амініотіокарбоніл, N-бутил-N-(1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-бутил-N-(2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-бутил-N-(1,1-диметилетил)-амініотіокарбоніл, N-(1-метилпропіл)-N-(2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-(1,1-диметилетил)-N-(2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-пентиламініотіокарбоніл, N-метил-N-(1-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(3-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2,2-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(і-етилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-гексиламініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,1-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,2-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(3-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(4-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,1-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,2-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2,2-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(3,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1-етилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(2-етилбутил)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-етил-N-(1,1,2-триметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1,2,2-триметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1-етил-1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-метил-N-(1-етил-2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-пентиламініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(3-метилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2,2-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-етилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-гексиламініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,1-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,2-диметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(3-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(4-метилпентил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,1-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,2-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2,2-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(3,3-диметилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-

етилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(2-етилбутил)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,1,2-триметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1,2,2-триметилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-етил-1-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-етил-N-(1-етил-2-метилпропіл)-амініотіокарбоніл, N-пропіл-N-пентиламініотіокарбоніл, N-бутил-N-пентиламініотіокарбоніл, N,N-дипентиламініотіокарбоніл, N-пропіл-N-гексиламініотіокарбоніл, N-бутил-N-гексиламініотіокарбоніл, N-пропіл-N-гексиламініотіокарбоніл або N,N-дигексиламініотіокарбоніл;

- гетероциклі, а також гетероциклільні частини гетероцикліл-С₁-С₆-алкілу, гетероциклілкарбонілу, гетероциклілкарбоніл-С₁-С₆-алкілу, гетероциклілоксикарбонілу, гетероцикліламінокарбонілу, гетероциклілсульфоніламінокарбонілу, N-(С₁-С₆-алкіл)-N-(гетероцикліл)-амінокарбонілу та гетероцикліл-С₁-С₆-алкілкарбонілу означають насичене, частково ненасичене або ароматичне 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, яке містить від одного до чотирьох однакових або різних гетероатомів, вибраних із групи, яка включає кисень, сірку або азот, і може бути зв'язане за допомогою С або N, наприклад,

С-приєднані, 5-членні насичені кільця, такі, як тетрагідрофуран-2-іл, тетрагідрофуран-3-іл, тетрагідротієн-2-іл, тетрагідротієн-3-іл, тетрагідропірол-2-іл, тетрагідропірол-3-іл, тетрагідропіразол-3-іл, тетрагідропіразол-4-іл, тетрагідроізоксазол-3-іл, тетрагідроізоксазол-4-іл, тетрагідроізоксазол-5-іл, 1,2-оксатіолан-3-іл, 1,2-оксатіолан-4-іл, 1,2-оксатіолан-5-іл, тетрагідроізотіазол-3-іл, тетрагідроізотіазол-4-іл, тетрагідроізотіазол-5-іл, 1,2-дитіолан-3-іл, 1,2-дитіолан-4-іл, тетрагідроімідазол-2-іл, тетрагідроімідазол-4-іл, тетрагідрооксазол-4-іл, тетрагідрооксазол-5-іл, тетрагідротіазол-2-іл, тетрагідротіазол-4-іл, тетрагідротіазол-5-іл, 1,3-діоксолан-2-іл, 1,3-діоксолан-4-іл, 1,3-оксатіолан-2-іл, 1,3-оксатіолан-4-іл, 1,3-оксатіолан-5-іл, 1,3-дитіолан-2-іл, 1,3-дитіолан-4-іл, 1,3,2-діоксатіолан-4-іл;

N-приєднані, 5-членні, насичені кільця, такі, як тетрагідропірол-1-іл, тетрагідропіразол-1-іл, тетрагідроізоксазол-2-іл, тетрагідроізотіазол-2-іл, тетрагідроімідазол-1-іл, тетрагідрооксазол-3-іл, тетрагідротіазол-3-іл;

С-приєднанні, 5-членні, частково ненасичені кільця, такі, як 2,3-дигідрофуран-2-іл, 2,3-дигідрофуран-3-іл, 2,5-дигідрофуран-2-іл, 2,5-дигідрофуран-3-іл, 4,5-дигідрофуран-2-іл, 4,5-дигідрофуран-3-іл, 2,3-дигідротієн-2-іл, 2,3-дигідротієн-3-іл, 2,5-дигідротієн-2-іл, 2,5-дигідротієн-3-іл, 4,5-дигідротієн-2-іл, 4,5-дигідротієн-3-іл, 2,3-дигідро-1Н-пірол-2-іл, 2,3-дигідро-1Н-пірол-3-іл, 2,5-дигідро-1Н-пірол-2-іл, 2,5-дигідро-1Н-пірол-3-іл, 4,5-дигідро-1Н-пірол-2-іл, 4,5-дигідро-1Н-пірол-3-іл, 3,4-дигідро-2Н-пірол-2-іл, 3,4-дигідро-2Н-пірол-3-іл, 3,4-дигідро-5Н-пірол-2-іл, 3,4-дигідро-5Н-пірол-3-іл, 4,5-дигідро-1Н-піразол-3-іл, 4,5-дигідро-1Н-піразол-4-іл, 4,5-дигідро-1Н-піразол-5-іл, 2,5-дигідро-1Н-піразол-3-

С-приєднані, 6-членні, частково ненасичені кільця, такі, як 2Н-3,4-дигідропіран-6-іл, 2Н-3,4-дигідропіран-5-іл, 2Н-3,4-дигідропіран-4-іл, 2Н-3,4-дигідропіран-3-іл, 2Н-3,4-дигідропіран-2-іл, 2Н-3,4-дигідропіран-6-іл, 2Н-3,4-дигідротіопіран-5-іл, 2Н-3,4-дигідротіопіран-4-іл, 2Н-3,4-дигідротіопіран-3-іл, 2Н-3,4-дигідротіопіран-2-іл, 1,2,3,4-тетрагідропіридин-6-іл, 1,2,3,4-тетрагідропіридин-5-іл, 1,2,3,4-тетрагідропіридин-4-іл, 1,2,3,4-тетрагідропіридин-3-іл, 1,2,3,4-тетрагідропіридин-2-іл, 2Н-5,6-дигідропіран-2-іл, 2Н-5,6-дигідропіран-3-іл, 2Н-5,6-дигідропіран-4-іл, 2Н-5,6-дигідропіран-5-іл, 2Н-5,6-дигідропіран-6-іл, 2Н-5,6-дигідротіопіран-2-іл, 2Н-5,6-дигідротіопіран-3-іл, 2Н-5,6-дигідротіопіран-4-іл, 2Н-5,6-дигідротіопіран-5-іл, 2Н-5,6-дигідротіопіран-6-іл, 1,2,5,6-тетрагідропіридин-2-іл, 1,2,5,6-тетрагідропіридин-3-іл, 1,2,5,6-тетрагідропіридин-4-іл, 1,2,5,6-тетрагідропіридин-5-іл, 1,2,5,6-тетрагідропіридин-6-іл, 2,3,4,5-тетрагідропіридин-2-іл, 2,3,4,5-тетрагідропіридин-3-іл, 2,3,4,5-тетрагідропіридин-4-іл, 2,3,4,5-тетрагідропіридин-5-іл, 2,3,4,5-

причому прикondенованим фенільним кільцем або C_3-C_6 -карбонцикліком або ще одним 5- або 6-членним гетероцикліком може бути утворена біциклічна кільцева система.

C-зв'язаний 5- або 6-членний гетероарил з одним-чотирма атомами азоту або з одним-трьома атомами азоту та одним атомом кисню або атомом сірки, або з одним атомом кисню або атомом сірки означає, наприклад, зв'язані C- атомом ароматичні 5-членні гетероцикли, які поряд з атомами вуглецю можуть містити від одного до чотирьох атомів азоту, або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню, або один атом сірки або кисню як члени кільця, наприклад, 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піроліл, 3-піроліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 3-ізотіазоліл, 4-ізотіазоліл, 5-ізотіазоліл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-5-іл, 1,2,4-тріазол-3-іл, 1,3,4-оксадіазол-2-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл та 1,3,4-тріазол-2-іл, наприклад, зв'язані через C- атом ароматичні 6-членні гетероцикли, які поряд з атомами вуглецю можуть містити від одного до чотирьох, переважно від одного до трьох атомів азоту як члени кільця, наприклад, 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-тріазин-2-іл та 1,2,4-тріазин-3-іл.

Всі фенільні кільця, відповідно, гетероциклічні залишки, а також всі фенільні компоненти в феніл-C₁-C₆-алкілі, фенілкарбонілі, фенілкарбоніл-C₁-C₆-алкілі, феноксикарбонілі, феніламінокарбонілі, фенілсульфоніламінокарбонілі, N-(C₁-C₆-алкіл)-N-феніламінокарбонілі та феніл-C₁-C₆-алкілкарбонілі та всі гетероциклічні компоненти в гетероцикліл-C₁-C₆-алкілі, гетероциклілкарбонілі, гетероциклілкарбоніл-C₁-C₆-алкілі, гетероциклілоксикарбонілі, гетероцикліламінокарбонілі, гетероциклілсульфоніламінокарбонілі, N-(C₁-C₆-алкіл)-N-гетероцикліламінокарбонілі та гетероцикліл-C₁-C₆-алкілкарбонілі, якщо не зазначено інше, є незаміщеними або мають від одного до трьох атомів галогену і/або нітрогрупу, ціано залишок і/або один або два метил-, трифторметил-, метокси- або трифторметокси-замісника.

В особливо кращій формі виконання змінні сполук формули I мають нижченаведені значення, причому вони являють собою окремо і у комбінації один з одним особливі форми виконання сполук формули I.

Кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹ означає галоген, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₆-галогеналкіл;

краще галоген або C₁-C₆-галогеналкіл;

особливо краще галоген або C₁-C₄-галогеналкіл;

надзвичайно краще фтор, хлор або CF₃.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R² означає водень, галоген, NO₂, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₆-галогеналкіл;

краще водень, галоген, NO₂ або C₁-C₆-галогеналкіл;

більш краще водень, галоген, NO₂ або C₁-C₄-галогеналкіл;

особливо краще водень, фтор, хлор, NO₂ або CF₃;

надзвичайно краще водень, фтор, хлор або NO₂;

найкраще водень, фтор або NO₂.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R² та R³ незалежно один від одного означають водень, галоген, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₆-галогеналкіл;

краще водень, галоген або C₁-C₆-галогеналкіл;

більш краще водень, галоген або C₁-C₄-галогеналкіл;

особливо краще водень, фтор, хлор або CF₃;

надзвичайно краще водень, фтор або хлор;

найкраще водень або фтор.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

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

краще водень, галоген або C₁-C₄-алкіл;

особливо краще водень або галоген;

надзвичайно краще водень.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁵ означає водень, галоген, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкіл;

краще водень, галоген або C₁-C₄-алкіл;

особливо краще водень або галоген;

надзвичайно краще водень.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁶ означає водень; і

R⁷ означає водень або гідроксид;

особливо краще водень.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁸ означає C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-галогеналкіл;

краще C₁-C₆-алкіл;

особливо краще C₁-C₄-алкіл;

надзвичайно краще CH₃.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁹ означає OR¹⁶ або SR¹⁷;

особливо краще OR¹⁶.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁹ означає OR¹⁶ або NR¹⁸R¹⁹;

особливо краще NR¹⁸R¹⁹.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R⁹ означає SR¹⁶ або NR¹⁸R¹⁹;

особливо краще SR¹⁶.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹⁰ означає водень або C₁-C₄-алкіл;

краще водень або CH₃;

особливо краще водень.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R^{11} означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, гідроксі, C_1-C_6 -алкокси, гідроксі- C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_6 -алкокси- C_1-C_4 -алкіл, три(C_1-C_6 -алкіл)силілокси- C_1-C_4 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, (C_1-C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, [ді-(C_1-C_4 -алкіл)-амінокарбоніл]оксі- C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 -алкілсульфоніламіно, C_1-C_4 -галогеналкілсульфоніламіно, (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно або феніл, причому фенільний залишок може мати від одного до трьох залишків, вибраних із групи, яка включає галоген, нітро, C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 -галогеналкіл, гідроксикарбоніл і C_1-C_6 -алкоксикарбоніл;

краще водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, гідроксі- C_1-C_4 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, (C_1-C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси або (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно;

більш краще водень, галоген, C_1-C_4 -алкіл, гідроксі- C_1-C_4 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, (C_1-C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси або (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно;

особливо краще водень, фтор, хлор, бром, CH_3 , гідроксі- C_1-C_4 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, (C_1-C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси або (C_1-C_6 -алкілкарбоніл)-аміно;

надзвичайно краще водень, фтор, CH_3 , гідроксі- C_1-C_4 -алкіл, (гідроксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси, (C_1-C_4 -алкоксикарбоніл)- C_1-C_4 -алкокси або (C_1-C_6 -алкілкарбоніл)-аміно.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R^{11} означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, гідроксі або C_1-C_6 -алкокси;

краще водень, галоген або C_1-C_6 -алкіл;

особливо краще водень, галоген або C_1-C_4 -алкіл;

більш краще водень, фтор, хлор, бром або CH_3 ;

надзвичайно краще водень, фтор або CH_3 .

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R^{12} означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галогеналкіл або (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно;

краще водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл або (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно;

особливо краще водень, галоген, C_1-C_4 -алкіл або (C_1-C_4 -алкілкарбоніл)-аміно.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R^{12} означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл або C_1-C_6 -галогеналкіл;

краще водень, галоген або C_1-C_6 -алкіл;

особливо краще водень, галоген або C_1-C_4 -алкіл;

надзвичайно краще водень або галоген;

найкраще водень, фтор або хлор.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, в якій

R^{13} , R^{14} та R^{15} кожен незалежно означає водень, галоген, ціано, C_1-C_4 -алкіл або C_1-C_4 -галогеналкіл;

краще водень, галоген або ціано;

особливо краще водень, фтор або хлор;

надзвичайно краще водень.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R^{16} , R^{17} та R^{18} кожен незалежно означає водень, C_1-C_6 -алкіл, C_3-C_6 -алкеніл, C_3-C_6 -алкініл, C_1-C_6 -алкілкарбоніл, C_2-C_6 -алкенілкарбоніл, C_3-C_6 -циклоалкілкарбоніл, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкіламінокарбоніл, C_1-C_6 -алкілсульфоніламінокарбоніл, ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_1-C_6 -алкокси)-N-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінотіокарбоніл, C_1-C_6 -алкоксиіміно- C_1-C_6 -алкіл,

причому названі алкільні, циклоалкільні й алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -алкілтіо, ді-(C_1-C_4 -алкіл)-аміно, C_1-C_4 -алкілкарбоніл,

гідроксикарбоніл, C_1-C_4 -алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1-C_4 -алкіламінокарбоніл, ді-(C_1-C_4 -алкіл)-амінокарбоніл або C_1-C_4 -алкілкарбонілокси;

феніл, феніл- C_1-C_6 -алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл- C_1-C_6 -алкіл, фенілсульфоніламінокарбоніл або C_1-C_6 -алкілкарбоніл,

причому фенільний залишок 6 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 -галогеналкіл, C_1-C_4 -алкокси або C_1-C_4 -галогеналкокси; або SO_2R^{20} ;

особливо краще водень, C_1-C_6 -алкіл, C_3-C_6 -алкеніл, C_3-C_6 -алкініл, C_1-C_6 -алкілкарбоніл, C_2-C_6 -алкенілкарбоніл, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкілсульфоніламінокарбоніл, ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_1-C_6 -алкокси)-N-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл або ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінотіокарбоніл,

причому названі алкільні або алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -алкоксикарбоніл, C_1-C_4 -алкіламінокарбоніл, ді-(C_1-C_4 -алкіл)-амінокарбоніл або C_1-C_4 -алкілкарбонілокси;

феніл- C_1-C_6 -алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл- C_1-C_6 -алкіл,

фенілсульфоніламінокарбоніл або феніл- C_1-C_6 -алкілкарбоніл, причому фенільне кільце 5 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогеноване і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 -галогеналкіл, C_1-C_4 -алкокси або C_1-C_4 -галогеналкокси; або SO_2R^{20} ;

краще водень, C_1-C_6 -алкіл, C_3-C_6 -алкеніл, C_3-C_6 -алкініл, C_1-C_6 -алкілкарбоніл, C_1-C_6 -алкенілкарбоніл, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, N-(C_1-C_6 -алкокси)-N-(C_1-C_6 -алкіл)-амінокарбоніл, ді-(C_1-C_6 -алкіл)-амінотіокарбоніл, феніл- C_1-C_6 -алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл- C_1-C_6 -алкіл або феніл- C_1-C_6 -алкілкарбоніл,

причому фенільне кільце 4 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогеноване і/або може мати від однієї до трьох

наступних груп: нітро, ціано, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси; або

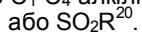


Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹⁶, R¹⁷ та R¹⁸ кожен незалежно один від одного означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₁-C₆-алкілкарбоніл,

C₂-C₆-алкенілкарбоніл, C₃-C₆-циклоалкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₁-C₆-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₆-алкокси)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл, ді-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл, C₁-C₆-алкоксиміно-C₁-C₆-алкіл, причому названі алкільні, циклоалкільні або алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп:

ціано, гідрокси, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно, C₁-C₄-алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл або C₁-C₄-алкілкарбонілокси;



Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹⁶ та R¹⁸ кожен незалежно один від одного означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₁-C₆-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₁-C₆-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₆-алкокси)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл,

причому названі алкільні та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл або ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл;

феніл-C₁-C₆-алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл-C₁-C₆-алкіл, феніламінокарбоніл, N-(C₁-C₆-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл або гетероциклілкарбоніл,

причому фенільний та гетероциклільний залишок 6 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп:

ціано, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкіл; або



особливо краще водень, C₁-C₄-алкіл, C₃-C₄-алкеніл, C₃-C₄-алкініл, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкокси)-N-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, причому названі алкільні та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл або ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл;

феніл-C₁-C₄-алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл-C₁-C₄-алкіл, феніламінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл або гетероциклілкарбоніл,

причому фенільний і гетероциклільний залишок 6 названих останніми замісників може

бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкіл; або



краще водень або C₁-C₄-алкіл,

причому названий алкільний залишок може бути частково або повністю галогенований і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл або ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл;

феніл-C₁-C₄-алкіл, фенілкарбоніл, фенілкарбоніл-C₁-C₄-алкіл, феніламінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл або гетероциклілкарбоніл, або



надзвичайно краще водень, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, феніламінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл, SO₂CH₃, SO₂CF₃ або SO₂(C₆H₅).

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹⁷ означає водень, C₁-C₆-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₁-C₆-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл або N-(C₁-C₆-алкокси)-N-(C₁-C₆-алкіл)-амінокарбоніл,

причому названі алкільний та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано або C₁-C₄-алкокси;

краще водень, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл або N-(C₁-C₄-алкокси)-N-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл,

причому названі алкільний та алкокси залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано або C₁-C₄-алкокси;

особливо краще водень, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкокси)-N-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R¹⁹ означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-алкеніл або C₃-C₆-алкініл,

причому 4 названих останніми замісника можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, гідрокси, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, ді-(C₁-C₄-алкіл)-аміно, C₁-C₄-алкілкарбоніл, гідроксикарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл або C₁-C₄-алкілкарбонілокси;

феніл або феніл-C₁-C₆-алкіл, причому фенільне кільце 2 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогеноване і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: нітро, ціано, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси;

особливо краще водень, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-алкеніл або C₃-C₆-алкініл,

причому 3 названих залишки можуть бути частково або повністю галогеновані і/або можуть

мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-алкоксикарбоніл, С₁-С₄-алкіламінокарбоніл, ді-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл або С₁-С₄-алкілкарбонілокси;

феніл або феніл-С₁-С₄-алкіл, причому фенільне кільце 2 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогеноване і/або може мати від одного до трьох наступних груп: нітро, ціано, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-алкокси або С₁-С₄-галогеналокси;

краще водень або С₁-С₆-алкіл, причому алкільний залишок може бути частково або повністю галогенований;

феніл або феніл-С₁-С₄-алкіл, причому фенільне кільце 2 названих останніми замісників може бути частково або повністю галогеноване і/або може мати від однієї до трьох наступних груп: ціано, С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкіл;

надзвичайно краще водень або С₁-С₄-алкіл.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, у якій

R²⁰ означає С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл або феніл, причому фенільний залишок може бути частково або повністю галогенований або і/або може бути заміщений С₁-С₄-алкілом;

краще С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл або феніл;

особливо краще метил, трифторметил або феніл.

Також кращі заміщені бензоїлом феніланінаміди формули I, в якій

R¹ означає фтор, хлор або CF₃,

R² та R³ незалежно один від одного означають водень, фтор або хлор,

R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ означають водень,

R⁸ означає С₁-С₄-алкіл,

особливо краще CH₃;

R⁹ означає OR¹⁶, SR¹⁷ або NR¹⁸R¹⁹,

R¹⁰ означає водень;

R¹¹ означає водень, галоген, ціано або С₁-С₄-алкіл,

особливо краще водень, фтор або CH₃;

R¹² означає водень, галоген або ціано,

особливо краще водень, фтор або хлор;

R¹³, R¹⁴ та R¹⁵ незалежно один від одного означають водень, фтор або хлор,

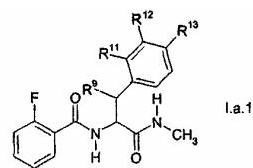
особливо краще водень;

R¹⁶ та R¹⁸ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₄-алкілкарбоніл, С₁-С₄-алкіламінокарбоніл, ді-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл, феніламінокарбоніл, N-(С₁-С₄-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл, SO₂CH₃, SO₂CF₃ або SO₂(C₆H₅);

R¹⁷ означає водень, С₁-С₄-алкілкарбоніл, С₁-С₄-алкоксикарбоніл, С₁-С₄-алкіламінокарбоніл, ді-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл, N-(С₁-С₄-алкокси)-N-(С₁-С₄-алкіл)-амінокарбоніл; та

R¹⁹ означає водень або С₁-С₄-алкіл.

Надзвичайно кращі сполуки формули I.a.1 (відповідають формулі I з R¹=F; R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹⁴, R¹⁵ = H; R⁸=CH₃), зокрема, сполуки формул I.a.1.1-I.a.1.558 таблиці 1, причому значення змінних R¹-R²⁰ відіграють особливу роль для сполук відповідно до винаходу не тільки в комбінації одне з одним, але й окремо.



Таблиця 1

№	R ⁹	R ¹¹	R ¹²	R ¹³
I.a.1.1	OH	H	H	H
I.a.1.2	OH	H	H	F
I.a.1.3	OH	H	F	H
I.a.1.4	OH	H	F	F
I.a.1.5	OH	H	Cl	H
I.a.1.6	OH	H	Cl	F
I.a.1.7	OH	F	H	H
I.a.1.8	OH	F	H	F
I.a.1.9	OH	F	F	H
I.a.1.10	OH	F	F	F
I.a.1.11	OH	F	Cl	H
I.a.1.12	OH	F	Cl	F
I.a.1.13	OH	CH ₃	H	H
I.a.1.14	OH	CH ₃	H	F
I.a.1.15	OH	CH ₃	F	H
I.a.1.16	OH	CH ₃	F	F
I.a.1.17	OH	CH ₃	Cl	H
I.a.1.18	OH	CH ₃	Cl	F
I.a.1.19	OC(O)CH ₃	H	H	H
I.a.1.20	OC(O)CH ₃	H	H	F
I.a.1.21	OC(O)CH ₃	H	F	H
I.a.1.22	OC(O)CH ₃	H	F	F
I.a.1.23	OC(O)CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.24	OC(O)CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.25	OC(O)CH ₃	F	H	H
I.a.1.26	OC(O)CH ₃	F	H	F
I.a.1.27	OC(O)CH ₃	F	F	H
I.a.1.28	OC(O)CH ₃	F	F	F
I.a.1.29	OC(O)CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.30	OC(O)CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.31	OC(O)CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.32	OC(O)CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.33	OC(O)CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.34	OC(O)CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.35	OC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.36	OC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.37	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	H
I.a.1.38	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	F
I.a.1.39	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	H
I.a.1.40	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	F
I.a.1.41	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	H
I.a.1.42	OC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	F
I.a.1.43	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	H
I.a.1.44	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	F
I.a.1.45	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	H

I.a.1.46	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	F
I.a.1.47	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	H
I.a.1.48	OC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	F
I.a.1.49	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	H
I.a.1.50	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	F
I.a.1.51	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	H
I.a.1.52	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	F
I.a.1.53	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	H
I.a.1.54	OC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	F
I.a.1.55	OC(O)NH(CH ₃)	H	H	H
I.a.1.56	OC(O)NH(CH ₃)	H	H	F
I.a.1.57	OC(O)NH(CH ₃)	H	F	H
I.a.1.58	OC(O)NH(CH ₃)	H	F	F
I.a.1.59	OC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	H
I.a.1.60	OC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	F
I.a.1.61	OC(O)NH(CH ₃)	F	H	H
I.a.1.62	OC(O)NH(CH ₃)	F	H	F
I.a.1.63	OC(O)NH(CH ₃)	F	F	H
I.a.1.64	OC(O)NH(CH ₃)	F	F	F
I.a.1.65	OC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	H
I.a.1.66	OC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	F
I.a.1.67	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	H
I.a.1.68	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	F
I.a.1.69	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	H
I.a.1.70	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	F
I.a.1.71	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.72	OC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.73	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.74	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.75	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.76	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.77	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.78	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.79	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.80	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.81	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.82	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.83	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.84	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.85	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.86	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.87	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.88	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.89	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.90	OC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.91	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	H
I.a.1.92	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	F
I.a.1.93	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	H
I.a.1.94	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	F
I.a.1.95	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	H
I.a.1.96	OC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	F
I.a.1.97	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	H
I.a.1.98	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	F
I.a.1.99	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	H
I.a.1.100	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	F
I.a.1.101	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	H
I.a.1.102	OC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	F
I.a.1.103	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H
I.a.1.104	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	F
I.a.1.105	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	H
I.a.1.106	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	F
I.a.1.107	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	H
I.a.1.108	OC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	F
I.a.1.109	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.110	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.111	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.112	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.113	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.114	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.115	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.116	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.117	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.118	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.119	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.120	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.121	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.122	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.123	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.124	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.125	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.126	OC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.127	OSO ₂ CH ₃	H	H	H

I.a.1.128	OSO ₂ CH ₃	H	H	F
I.a.1.129	OSO ₂ CH ₃	H	F	H
I.a.1.130	OSO ₂ CH ₃	H	F	F
I.a.1.131	OSO ₂ CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.132	OSO ₂ CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.133	OSO ₂ CH ₃	F	H	H
I.a.1.134	OSO ₂ CH ₃	F	H	F
I.a.1.135	OSO ₂ CH ₃	F	F	H
I.a.1.136	OSO ₂ CH ₃	F	F	F
I.a.1.137	OSO ₂ CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.138	OSO ₂ CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.139	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.140	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.141	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.142	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.143	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.144	OSO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.145	SH	H	H	H
I.a.1.146	SH	H	H	F
I.a.1.147	SH	H	F	H
I.a.1.148	SH	H	F	F
I.a.1.149	SH	H	Cl	H
I.a.1.150	SH	H	Cl	F
I.a.1.151	SH	F	H	H
I.a.1.152	SH	F	H	F
I.a.1.153	SH	F	F	H
I.a.1.154	SH	F	F	F
I.a.1.155	SH	F	Cl	H
I.a.1.156	SH	F	Cl	F
I.a.1.157	SH	CH ₃	H	H
I.a.1.158	SH	CH ₃	H	F
I.a.1.159	SH	CH ₃	F	H
I.a.1.160	SH	CH ₃	F	F
I.a.1.161	SH	CH ₃	Cl	H
I.a.1.162	SH	CH ₃	Cl	F
I.a.1.163	SC(O)CH ₃	H	H	H
I.a.1.164	SC(O)CH ₃	H	H	F
I.a.1.165	SC(O)CH ₃	H	F	H
I.a.1.166	SC(O)CH ₃	H	F	F
I.a.1.167	SC(O)CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.168	SC(O)CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.169	SC(O)CH ₃	F	H	H
I.a.1.170	SC(O)CH ₃	F	H	F
I.a.1.171	SC(O)CH ₃	F	F	H
I.a.1.172	SC(O)CH ₃	F	F	F
I.a.1.173	SC(O)CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.174	SC(O)CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.175	SC(O)CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.176	SC(O)CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.177	SC(O)CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.178	SC(O)CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.179	SC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.180	SC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.181	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	H
I.a.1.182	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	F
I.a.1.183	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	H
I.a.1.184	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	F
I.a.1.185	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	H
I.a.1.186	SC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	F
I.a.1.187	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	H
I.a.1.188	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	F
I.a.1.189	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	H
I.a.1.190	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	F
I.a.1.191	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	H
I.a.1.192	SC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	F
I.a.1.193	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	H
I.a.1.194	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	F
I.a.1.195	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	H
I.a.1.196	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	F
I.a.1.197	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	H
I.a.1.198	SC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	F
I.a.1.199	SC(O)NH(CH ₃)	H	H	H
I.a.1.200	SC(O)NH(CH ₃)	H	H	F
I.a.1.201	SC(O)NH(CH ₃)	H	F	H
I.a.1.202	SC(O)NH(CH ₃)	H	F	F
I.a.1.203	SC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	H
I.a.1.204	SC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	F
I.a.1.205	SC(O)NH(CH ₃)	F	H	H
I.a.1.206	SC(O)NH(CH ₃)	F	H	F
I.a.1.207	SC(O)NH(CH ₃)	F	F	H
I.a.1.208	SC(O)NH(CH ₃)	F	F	F
I.a.1.209	SC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	H

I.a.1.210	SC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	F
I.a.1.211	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	H
I.a.1.212	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	F
I.a.1.213	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	H
I.a.1.214	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	F
I.a.1.215	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.216	SC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.217	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.218	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.219	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.220	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.221	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.222	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.223	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.224	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.225	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.226	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.227	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.228	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.229	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.230	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.231	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.232	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.233	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.234	SC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.235	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	H
I.a.1.236	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	F
I.a.1.237	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	H
I.a.1.238	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	F
I.a.1.239	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	H
I.a.1.240	SC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	F
I.a.1.241	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	H
I.a.1.242	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	F
I.a.1.243	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	H
I.a.1.244	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	F
I.a.1.245	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	H
I.a.1.246	SC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	F
I.a.1.247	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H
I.a.1.248	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	F
I.a.1.249	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	H
I.a.1.250	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	F

I.a.1.251	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	H
I.a.1.252	SC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	F
I.a.1.253	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.254	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.255	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.256	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.257	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.258	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.259	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.260	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.261	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.262	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.263	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.264	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.265	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.266	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.267	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.268	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.269	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.270	SC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.271	NH ₂	H	H	H
I.a.1.272	NH ₂	H	H	F
I.a.1.273	NH ₂	H	F	H
I.a.1.274	NH ₂	H	F	F
I.a.1.275	NH ₂	H	Cl	H
I.a.1.276	NH ₂	H	Cl	F
I.a.1.277	NH ₂	F	H	H
I.a.1.278	NH ₂	F	H	F
I.a.1.279	NH ₂	F	F	H
I.a.1.280	NH ₂	F	F	F
I.a.1.281	NH ₂	F	Cl	H
I.a.1.282	NH ₂	F	Cl	F
I.a.1.283	NH ₂	CH ₃	H	H
I.a.1.284	NH ₂	CH ₃	H	F
I.a.1.285	NH ₂	CH ₃	F	H
I.a.1.286	NH ₂	CH ₃	F	F
I.a.1.287	NH ₂	CH ₃	Cl	H
I.a.1.288	NH ₂	CH ₃	Cl	F
I.a.1.289	NHC(O)CH ₃	H	H	H
I.a.1.290	NHC(O)CH ₃	H	H	F
I.a.1.291	NHC(O)CH ₃	H	F	H

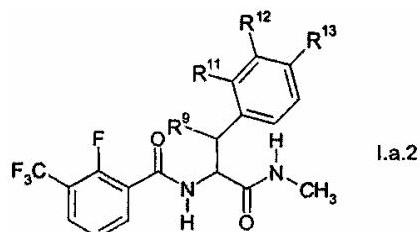
I.a.1.292	NHC(O)CH ₃	H	F	F
I.a.1.293	NHC(O)CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.294	NHC(O)CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.295	NHC(O)CH ₃	F	H	H
I.a.1.296	NHC(O)CH ₃	F	H	F
I.a.1.297	NHC(O)CH ₃	F	F	H
I.a.1.298	NHC(O)CH ₃	F	F	F
I.a.1.299	NHC(O)CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.300	NHC(O)CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.301	NHC(O)CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.302	NHC(O)CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.303	NHC(O)CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.304	NHC(O)CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.305	NHC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.306	NHC(O)CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.307	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	H
I.a.1.308	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	F
I.a.1.309	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	H
I.a.1.310	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	F
I.a.1.311	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	H
I.a.1.312	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	F
I.a.1.313	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	H
I.a.1.314	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	F
I.a.1.315	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	H
I.a.1.316	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	F
I.a.1.317	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	H
I.a.1.318	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	F
I.a.1.319	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	H
I.a.1.320	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	F
I.a.1.321	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	H
I.a.1.322	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	F
I.a.1.323	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	H
I.a.1.324	NHC(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	F
I.a.1.325	NHC(O)NH(CH ₃)	H	H	H
I.a.1.326	NHC(O)NH(CH ₃)	H	H	F
I.a.1.327	NHC(O)NH(CH ₃)	H	F	H
I.a.1.328	NHC(O)NH(CH ₃)	H	F	F
I.a.1.329	NHC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	H
I.a.1.330	NHC(O)NH(CH ₃)	H	Cl	F
I.a.1.331	NHC(O)NH(CH ₃)	F	H	H
I.a.1.332	NHC(O)NH(CH ₃)	F	H	F
I.a.1.333	NHC(O)NH(CH ₃)	F	F	H
I.a.1.334	NHC(O)NH(CH ₃)	F	F	F
I.a.1.335	NHC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	H
I.a.1.336	NHC(O)NH(CH ₃)	F	Cl	F
I.a.1.337	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	H
I.a.1.338	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	F
I.a.1.339	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	H
I.a.1.340	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	F
I.a.1.341	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.342	NHC(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.343	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.344	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.345	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.346	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.347	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.348	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.349	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.350	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.351	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.352	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.353	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.354	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.355	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.356	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.357	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.358	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.359	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.360	NHC(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.361	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	H
I.a.1.362	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	H	F
I.a.1.363	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	H
I.a.1.364	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	F	F
I.a.1.365	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	H
I.a.1.366	NHC(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	F
I.a.1.367	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	H
I.a.1.368	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	H	F
I.a.1.369	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	H
I.a.1.370	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	F	F
I.a.1.371	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	H
I.a.1.372	NHC(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	F
I.a.1.373	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H

I.a.1.374	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	F
I.a.1.375	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	H
I.a.1.376	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	F
I.a.1.377	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	H
I.a.1.378	NHC(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	F
I.a.1.379	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.380	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.381	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.382	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.383	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.384	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.385	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.386	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.387	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.388	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.389	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.390	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.391	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.392	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.393	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.394	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.395	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.396	NHC(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.397	NHSO ₂ CH ₃	H	H	H
I.a.1.398	NHSO ₂ CH ₃	H	H	F
I.a.1.399	NHSO ₂ CH ₃	H	F	H
I.a.1.400	NHSO ₂ CH ₃	H	F	F
I.a.1.401	NHSO ₂ CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.402	NHSO ₂ CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.403	NHSO ₂ CH ₃	F	H	H
I.a.1.404	NHSO ₂ CH ₃	F	H	F
I.a.1.405	NHSO ₂ CH ₃	F	F	H
I.a.1.406	NHSO ₂ CH ₃	F	F	F
I.a.1.407	NHSO ₂ CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.408	NHSO ₂ CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.409	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.410	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.411	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.412	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.413	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.414	NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.415	NH(CH ₃)	H	H	H
I.a.1.416	NH(CH ₃)	H	H	F
I.a.1.417	NH(CH ₃)	H	F	H
I.a.1.418	NH(CH ₃)	H	F	F
I.a.1.419	NH(CH ₃)	H	Cl	H
I.a.1.420	NH(CH ₃)	H	Cl	F
I.a.1.421	NH(CH ₃)	F	H	H
I.a.1.422	NH(CH ₃)	F	H	F
I.a.1.423	NH(CH ₃)	F	F	H
I.a.1.424	NH(CH ₃)	F	F	F
I.a.1.425	NH(CH ₃)	F	Cl	H
I.a.1.426	NH(CH ₃)	F	Cl	F
I.a.1.427	NH(CH ₃)	CH ₃	H	H
I.a.1.428	NH(CH ₃)	CH ₃	H	F
I.a.1.429	NH(CH ₃)	CH ₃	F	H
I.a.1.430	NH(CH ₃)	CH ₃	F	F
I.a.1.431	NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.432	NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.433	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	H	H
I.a.1.434	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	H	F
I.a.1.435	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	F	H
I.a.1.436	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	F	F
I.a.1.437	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.438	N(CH ₃)C(O)CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.439	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	H	H
I.a.1.440	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	H	F
I.a.1.441	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	F	H
I.a.1.442	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	F	F
I.a.1.443	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.444	N(CH ₃)C(O)CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.445	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.446	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.447	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.448	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.449	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.450	N(CH ₃)C(O)CH ₃	CH ₃	Cl	F
I.a.1.451	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	H
I.a.1.452	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	H	F
I.a.1.453	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	H
I.a.1.454	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	F	F
I.a.1.455	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	H

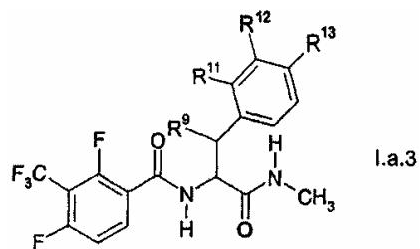
I.a.1.456	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	H	Cl	F
I.a.1.457	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	H
I.a.1.458	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	H	F
I.a.1.459	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	H
I.a.1.460	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	F	F
I.a.1.461	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	H
I.a.1.462	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	F	Cl	F
I.a.1.463	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	H
I.a.1.464	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	H	F
I.a.1.465	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	H
I.a.1.466	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	F	F
I.a.1.467	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	H
I.a.1.468	N(CH ₃)C(O)mpemC ₄ H ₉	CH ₃	Cl	F
I.a.1.469	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	H	H
I.a.1.470	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	H	F
I.a.1.471	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	F	H
I.a.1.472	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	F	F
I.a.1.473	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	Cl	H
I.a.1.474	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	H	Cl	F
I.a.1.475	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	H	H
I.a.1.476	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	H	F
I.a.1.477	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	F	H
I.a.1.478	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	F	F
I.a.1.479	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	Cl	H
I.a.1.480	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	F	Cl	F
I.a.1.481	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	H
I.a.1.482	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	F
I.a.1.483	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	H
I.a.1.484	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	F	F
I.a.1.485	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.486	N(CH ₃)C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.487	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.488	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	H	1
I.a.1.489	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.490	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.491	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.492	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.493	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.494	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.495	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.496	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.497	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.498	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.499	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.500	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.501	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H
I.a.1.502	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.503	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.504	N(CH ₃)C(O)NH(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.505	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	H	H
I.a.1.506	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	H	F
I.a.1.507	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	F	H
I.a.1.508	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	F	F
I.a.1.509	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	H
I.a.1.510	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	H	Cl	F
I.a.1.511	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	H	H
I.a.1.512	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	H	F
I.a.1.513	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	F	H
I.a.1.514	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	F	F
I.a.1.515	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	H
I.a.1.516	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	F	Cl	F
I.a.1.517	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H
I.a.1.518	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	F
I.a.1.519	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	H
I.a.1.520	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	F	F
I.a.1.521	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	H
I.a.1.522	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	F
I.a.1.523	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	H
I.a.1.524	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	H	F
I.a.1.525	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	H
I.a.1.526	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	F	F
I.a.1.527	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	H
I.a.1.528	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	Cl	F
I.a.1.529	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	H
I.a.1.530	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	H	F
I.a.1.531	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	H
I.a.1.532	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	F	F
I.a.1.533	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	H
I.a.1.534	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	F	Cl	F
I.a.1.535	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	H
I.a.1.536	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	H	F
I.a.1.537	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	H

I.a.1.538	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	F	F
I.a.1.539	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	H
I.a.1.540	N(CH ₃)C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	CH ₃	Cl	F
I.a.1.541	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	H
I.a.1.542	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	F
I.a.1.543	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	F	H
I.a.1.544	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	F	F
I.a.1.545	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	Cl	H
I.a.1.546	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	Cl	F
I.a.1.547	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	H	H
I.a.1.548	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	H	F
I.a.1.549	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	F	H
I.a.1.550	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	F	F
I.a.1.551	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	Cl	H
I.a.1.552	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	F	Cl	F
I.a.1.553	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H
I.a.1.554	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	F
I.a.1.555	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	F	H
I.a.1.556	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	F	F
I.a.1.557	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	H
I.a.1.558	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	F

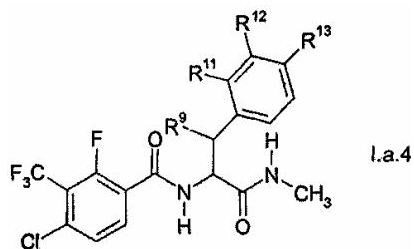
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.2, зокрема сполуки формул I.a.2.1-I.a.2.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R² означає CF₃.



Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.3, зокрема сполуки формул I.a.3.1-I.a.3.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R² означає CF₃ та R³ означає фтор.

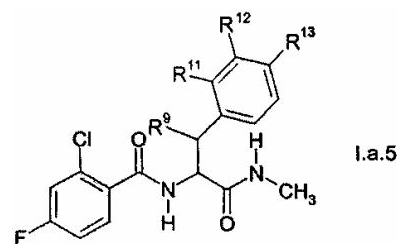


Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.4, зокрема сполуки формул I.a.4.1-I.a.4.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R² означає CF₃ та R³ означає хлор.

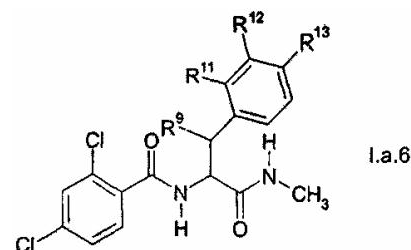


Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.5, зокрема сполуки формул I.a.5.1-I.a.5.558, які

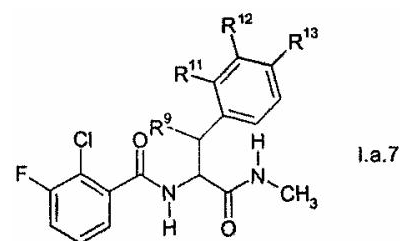
відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає хлор та R³ означає фтор.



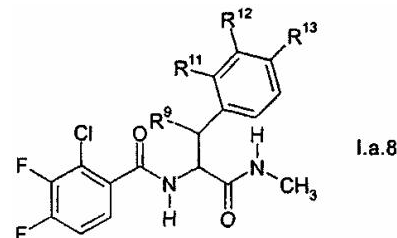
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.6, зокрема сполуки формули I.a.6.1-I.a.6.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ та R³ означають хлор.



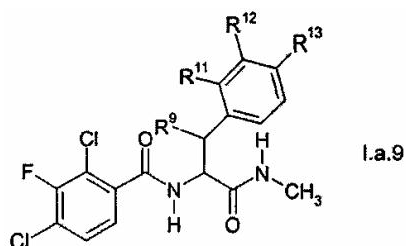
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.7, зокрема сполуки формул I.a.7.1-I.a.7.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає хлор та R³ означає фтор.



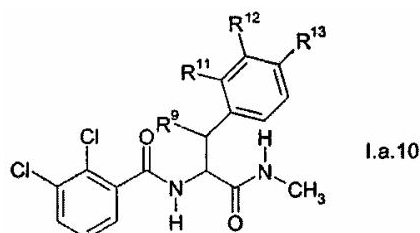
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.8, зокрема сполуки формул I.a.8.1-I.a.8.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає хлор та R², а також R³ означають фтор.



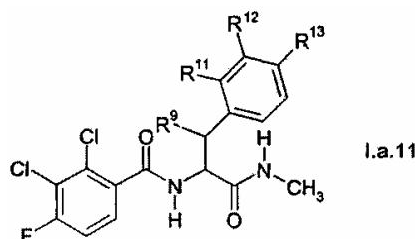
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.9, зокрема сполуки формул I.a.9.1-I.a.9.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ та R³ означають хлор та R² означає фтор.



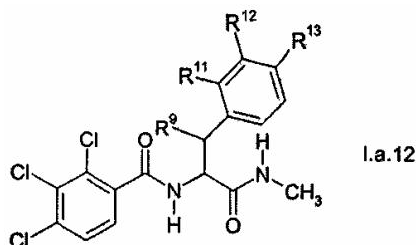
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.10, зокрема сполуки формул І.а.10.1-І.а.10.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R¹ та R² означають хлор.



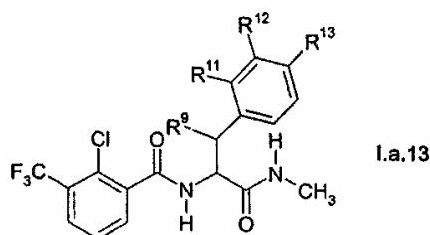
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.11, зокрема сполуки формул І.а.11.1-І.а.11.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1-І.а.1.558 тим, що R¹ та R² означають хлор та R³ означає фтор.



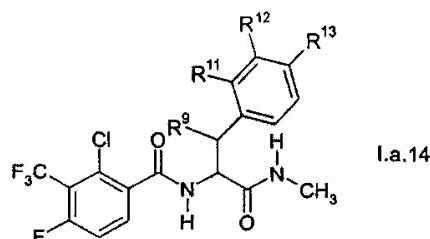
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.12, зокрема сполуки формул І.а.12.1-І.а.12.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R^1 , R^2 та R^3 означають хлор.



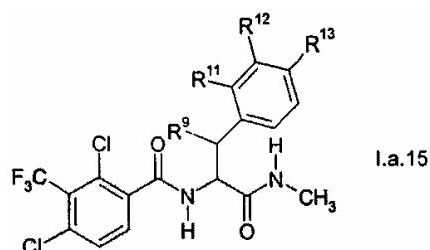
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.13, зокрема сполуки формул І.а.13.1-І.а.13.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R¹ означає хлор та R² означає CF₃.



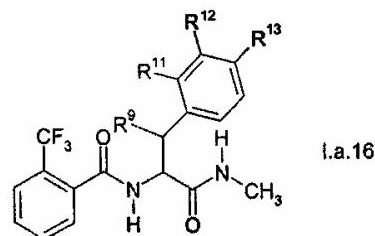
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.14, зокрема сполуки формул І.а.14.1-І.а.14.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R¹ означає хлор, R² означає CF₃ та R³ означає фтор.



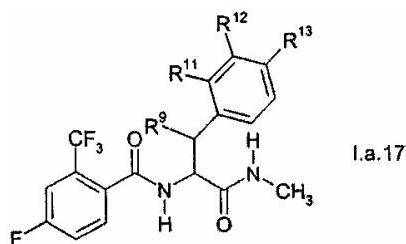
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.15, зокрема сполуки формул І.а.15.1-І.а.15.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R¹ та R³ означають хлор та R² означає CF₃.



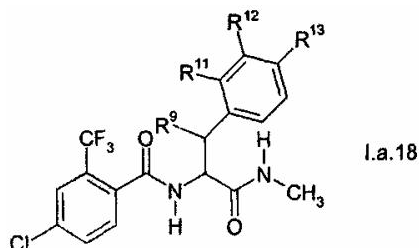
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.16, зокрема сполуки формул I.a.16.1-I.a.16.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃.



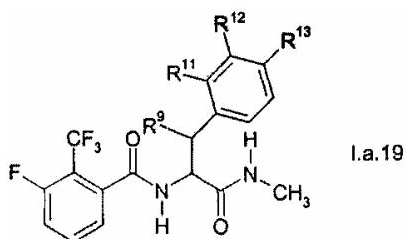
Також надзвичайно кращі сполуки формули І.а.17, зокрема сполуки формул І.а.17.1-І.а.17.558, які відрізняються від відповідних сполук формул І.а.1.1-І.а.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R³ означає фтор.



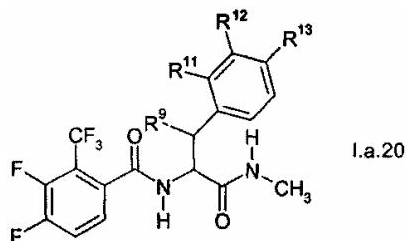
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.18, зокрема сполуки формул I.a.18.1-I.a.18.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R³ означає хлор.



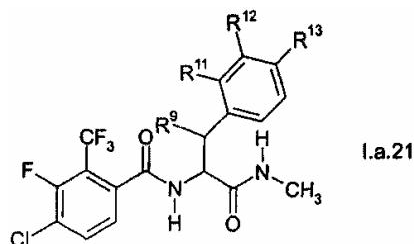
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.19, зокрема сполуки формул I.a.19.1-I.a.19.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R² означає фтор.



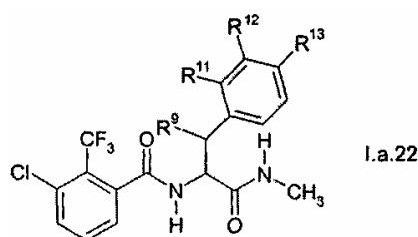
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.20, зокрема сполуки формул I.a.20.1-I.a.20.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R², а також R³ означають фтор.



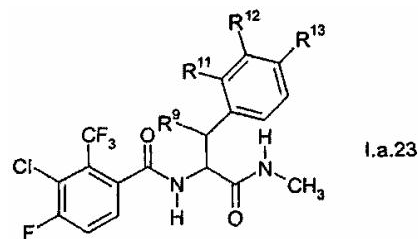
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.21, зокрема сполуки формул I.a.21.1-I.a.21.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃, R² означає фтор та R³ означає хлор.



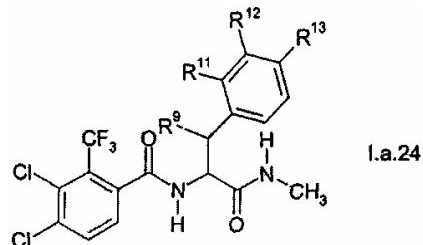
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.22, зокрема сполуки формул I.a.22.1-I.a.22.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R² означає хлор.



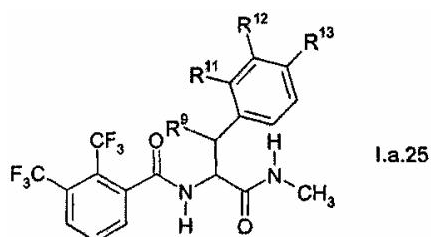
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.23, зокрема сполуки формул I.a.23.1-I.a.23.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃, R² означає хлор та R³ означає фтор.



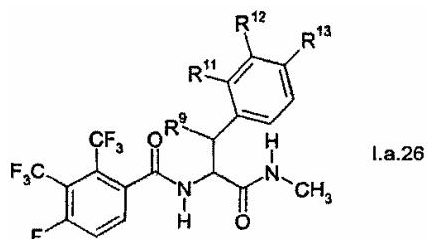
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.24, зокрема сполуки формул I.a.24.1-I.a.24.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R², а також R³ означають хлор.



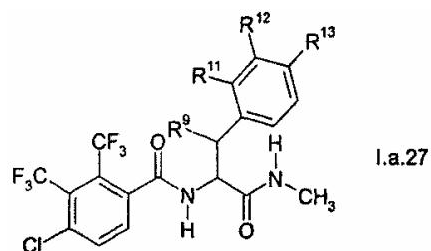
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.25, зокрема сполуки формул I.a.25.1-I.a.25.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ та R² означають CF₃.



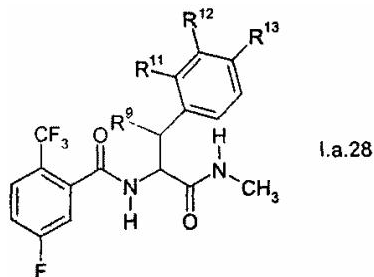
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.26, зокрема сполуки формул I.a.26.1-I.a.26.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ та R² означають CF₃ та R³ означає фтор.



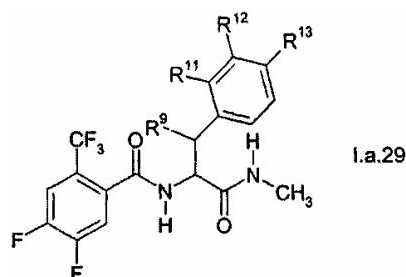
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.27, зокрема сполуки формул I.a.27.1-I.a.27.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ та R² означають CF₃ та R³ означає хлор.



Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.28, зокрема сполуки формул I.a.28.1-I.a.28.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R⁴ означає фтор.



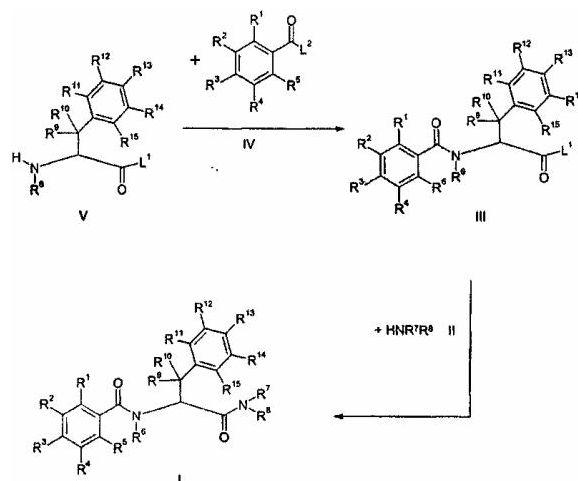
Також надзвичайно кращі сполуки формули I.a.29, зокрема сполуки формул I.a.29.1-I.a.29.558, які відрізняються від відповідних сполук формул I.a.1.1-I.a.1.558 тим, що R¹ означає CF₃ та R³, а також R⁴ означають фтор.



Заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I можуть бути одержані різним шляхом, наприклад, відповідно до наступних способів:

Спосіб А

Фенілаланіни формули V спочатку вводять у взаємодію з бензойними кислотами, відповідно, похідними бензойних кислот формули IV з одержанням відповідного похідної бензоїлу формули III, яка потім реагує з аміном формули II з утворенням цільових заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I:



L¹ означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид або C₁-C₆-алкокси.

L² означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид, галоген, C₁-C₆-алкіл карбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, фосфорил або ізоуреїл.

Взаємодія фенілаланінів формули V з бензойною кислотою (похідними) формули IV, де L² означає гідроксид, з одержанням похідних бензоїлу формули III здійснюється в присутності реагенту активування та основи звичайно при температурі від 0°C до точки кипіння реакційної суміші, переважно від 0°C до 110°C, особливо краще при кімнатній температурі в інертному органічному розчиннику [порівн. публікації Bergmann, E. D.; et al., J Chem Soc 1951, 2673; Zhdkanin, V. V.; et al., Tetrahedron Lett. 2000, 41 (28), 5299-5302; Martin, S. F. et al., Tetrahedron Lett. 1998, 39 (12), 1517-1520; Jursic, B. S. et al., Synth Commun 2001, 31 (4), 555-564; Albrecht, M. et al., Synthesis 2001, (3), 468-472; Yadav, L. D. S. et al., Indian J. Chem B. 41 (3), 593-595 (2002); Clark, J. E. et al., Synthesis (10), 891-894 (1991)].

Придатними реагентами активування є агенти конденсації, такі, як зв'язаний полістиролом дициклогексилкарбодіїмід, діізопропілкарбодіїмід, карбонілдіїмідазол, складні ефіри хлорвугільної кислоти, такі, як метилхлороформіат, етилхлороформіат, ізопропілхлороформіат, ізобутилхлороформіат, втор-бутилхлороформіат або алілхлороформіат, півалоїлхлорид, поліфосфорна кислота, ангідрид пропанфосфонової кислоти, біс-(2-оксо-3-оксазолідиніл)-фосфорилхлорид (BOPCl) або сульфонілхлориди, такі, як метансульфонілхлорид, толуолсульфонілхлорид або безолсульфонілхлорид.

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан і суміші C₅-C₈-алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран (THF), нітрили, такі, як ацетонітрил і пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, а також диметилсульфоксид, диметилформамід (DMF), диметилацетамід (DMA) і N-метилпіролідон (NMP) або ж вода, особливо кращі метиленхлорид, THF і вода. Можуть також застосовуватися суміші названих розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію й оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін, і N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин і 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, триетиламін і піримідин.

Основи загалом застосовуються в еквімолярних кількостях. Вони можуть також застосовуватися в надлишку або, якщо необхідно, як розчинник.

Вихідні продукти загалом вводять у взаємодію один з одним в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування сполуки IV у надлишку в перерахунку на сполуку V.

Реакційні суміші переробляються звичайним чином, наприклад, змішанням з водою, розділенням фаз та, якщо необхідно, хроматографічним очищенням сирих продуктів. Проміжні та кінцеві продукти утворюються звичайно у формі в'язких масел, які вивільняються при зниженому тиску та при помірно підвищеній температурі від летких компонентів та

очищаються. Якщо проміжні та кінцеві продукти утворюються у вигляді твердих речовин, може здійснюватися очищення перекристалізацією або дигеруванням.

Взаємодію фенілаланінів формули V з бензойними кислотами (похідними) формули IV, де L² означає галоген або C₁-C₆-алкокси, з одержанням похідних бензоїлу формули III здійснюють в присутності основи звичайно при температурі від 0°C до точки кипіння реакційної суміші, переважно від 0°C до 100°C, особливо краще при кімнатній температурі в інертному органічному розчиннику [порівн. публікації Bergmann, E. D.; et al., J Chem Soc 1951, 2673; Zhdankin, V. V.; et al., Tetrahedron Lett. 2000, 41 (28), 5299-5302; Martin, S. F. et al., Tetrahedron Lett. 1998, 39 (12), 1517-1520; Jursic, B. S. et al., Synth Commun 2001, 31 (4), 555-564; Albrecht, M. et al., Synthesis 2001, (3), 468-472; Yadav, L. D. S. et al., Indian J. Chem B. 41(3), 593-595 (2002); Clark, J. E. et al., Synthesis (10), 891-894 (1991)].

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C₅-C₈-алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран (THF), нітрили, такі, як ацетонітрил і пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метил етил кетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, а також диметилсульфоксид, диметилформамід (DMF), диметилацетамід (DMA) і N-метилпіролідон (NMP) або ж вода, особливо кращі метиленхлорид, THF і вода. Можуть також застосовуватися суміші названих розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію й оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін і N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин і 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, триетиламін і піримідин.

Основи загалом застосовуються в еквімолярних кількостях. Вони можуть також застосовуватися в надлишку або, якщо необхідно, як розчинник.

Вихідні продукти загалом вводять у взаємодію один з одним в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування сполуки IV у надлишку в перерахунку на сполуку V.

Обробку та виділення продуктів можна здійснювати відомим самим по собі шляхом.

Звичайно, аналогічним чином спочатку можна фенілаланіни формули V вводити у взаємодію з амінами формули II з одержанням відповідних амінів, які потім вводити у реакцію з бензойною кислотою (похідними) формули IV з одержанням цільових заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I.

Необхідні для одержання похідних бензоїлу формули III фенілаланіни формули V, де L¹ означають гідрокси, також і у формі енантіомерів і діастереомерів, відомі з літературних джерел або можуть бути одержані відповідно до цитованих літературних джерел:



- конденсація еквівалентів гліциноляту з бензальдегідами [Hvidt, T. et al., *Tetrahedron Lett.* 27 (33), 3807-3810 (1986); Saeed, A. et al., *Tetrahedron* 48 (12), 2507-2514 (1992); Kikuchi, J. et al., *Chem. Lett.* (3), 553-556 (1993); Soloshonok, V. A. et al., *Tetrahedron Lett.* 35 (17), 2713-2716 (1994); Soloshonok, V. A.; et al.; *Tetrahedron* 52 (1), 245-254 (1996); Rozenberg, V. et al., *Angew. Chem.* 106 (1), 106-108 (1994); US 4605759; Alker, D. et al., *Tetrahedron* 54 (22), 6089-6098 (1998); Shengde, W. et al., *Synth. Commun.* 16 (12), 1479 (1986); JP 2001046076; Herbert, R. B. et al., *Can. J. Chem.* 72 (1), 114-117 (1994)];

- розщепленням 2-N-фталойл-3-гідроксифенілаланінів [Hutton, C. A., *Org. Lett.* 1 (2), 295-297 (1999)];

- окисним аміногідроксилуванням і наступним видаленням захисної групи похідних коричної кислоти [Kim, I. H. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (48), 8401-8403 (2001)];

- розщепленням заміщених оксазолідинів [Wu, S. D. et al., *Synthetic Commun.* 16 (12), 1479-1484 (1986)];

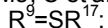
- розщепленням заміщених оксазолінів [Soloshonok, V. A.; et al.; *Tetrahedron* 52 (1), 245-254 (1996); Lown, J. W. et al., *Can. J. Chem.* 51, 856 (1973)];

- розщепленням заміщених 2-оксазолідинів [Jung, M. E. et al., *Tetrahedron Lett.* 30 (48), 6637-6640 (1989)];

- розщепленням заміщених 5-оксазолідинів [Blaser, D. et al., *Liebigs Ann. Chem.* (10), 1067-1078 (1991)];

- гідролізом похідних фенілсерин-нітрилу [Iriuchijima, S. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 96, 4280 (1974)];

- розщепленням заміщених імідазолін-4-онів [Davis, C. et al., *J. Chem. Soc.* 3479 (1951)]



- розщепленням похідних 2-ациламіно-3-тіоалкілфенілаланіну [Villeneuve, G. et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans 1* (16), 1897-1904 (1993)]

- розкриттям кільця тіазолідинтіонінів [Cook, A. H. et al., *J. Chem. Soc.* 1337 (1948)].



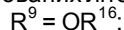
- розкриттям кільця заміщених імідазоліонів [Kavakova, I. K. et al., *Org. Prep. Proced. Int.* 28 (3), 333-338 (1996)]

- розкриттям кільця заміщених імідазолінів [Meyer R., *Liebigs Ann. Chem.*, 1183 (1977); Hayashi, T. et al., *Tetrahedron Lett.* 37 (28), 4969-4972 (1996); Lin, Y. R. et al., *J. Org. Chem.* 62 (6), 1799-1803 (1997); Zhou, X. T. et al., *Tetrahedron Assym.* 10 (5), 855-862 (1999)]

- відновленням похідних 2-ацидо-3-амінофенілаланіну [Moyna, G. et al., *Synthetic Commun.* 27 (9), 1561-1567 (1997)]

- гідруванням заміщених імідазолідинів [Alker, D. et al., *Tetrahedron Lett.* 39 (5-6), 475-478 (1998)].

Необхідні для одержання похідних бензоїлу формули III фенілаланіни формули V де L означає C₁-C₆-алкокси, також і у формі чистих енантіомерів та діастереомерів, відомі з літературних джерел або можуть бути одержані відповідно до цитованих літературних джерел:



- конденсацією еквівалентів гліциноляту з альдегідами: [Nicolaou, K. C. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 124 (35), 10451-10455 (2002); Carrara, G. et al., *Gazz. Chim. Ital.* 82, 325 (1952); Fuganti, C. et al., *J. Org. Chem.* 51 (7), 1126-1128 (1986); Boger, D. L. et al., *J. Org. Chem.* 62 (14), 4721-4736 (1997); Honig, H. et al., *Tetrahedron* (46), 3841 (1990); Kanemasa, S. et al., *Tetrahedron Lett.* 34 (4), 677-680 (1993); US 4873359]

- розщепленням дигідропіразинів [Li, Y. Q. et al., *Tetrahedron Lett.* 40 (51), 9097-9100 (1999); Beulshausen, T. et al., *Liebigs Ann. Chem.* (11), 1207-1209 (1991)]

- відновленням похідних N-амінофенілсерину [Poupardin, O. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (8), 1523-1526 (2001)]

- розщепленням похідних N-карбамоїлфенілсерину [Park, H. et al., *J. Org. Chem.* 66 (21), 7223-7226 (2001); US 6057473; Kim, I. H. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (48), 8401-8403 (2001); Nicolaou, K. C. et al., *Angew. N. Chem. Int. Edit.* 37 (19), 2714-2716 (1998)]

- розщепленням заміщених оксазолідинів [Zhou, C. Y. et al., *Synthetic Commun.* 17 (11), 1377-1382 (1987)]

- відновленням похідних 2-ацидо-3-гідроксифенілпропіонової кислоти [Corey, E. J. et al., *Tetrahedron Lett.* 32 (25), 2857-2860 (1991)]

- розкриттям кільця азиридинів з кисневмісними нуклеофілами [Davis, F. A. et al., *J. Org. Chem.* 59 (12), 3243-3245 (1994)]

- розщепленням заміщених 2-оксазолідинів [Jung, M. E. et al., *Synlett* 563-564 (1995)]

- відновленням похідних 2-гідроксіміно-3-кетифенілпропіонової кислоти [Inoue, H. et al., *Chem. Phar. Bull.* 41 (9), 1521-1523 (1993); Chang, Y. T. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 75, 89 (1953); US 4810817]

- гідролізом фенілсериніміно-похідних [Solladiecavallo, A. et al., *Gazz. Chim. Ital.* 126 (3), 173-178 (1996); Solladiecavallo, A. et al., *Tetrahedron Lett.* 39 (15), 2191-2194 (1998)]

- розщепленням похідних N-ацилфенілсерину [Girard, A. et al., *Tetrahedron Lett.* 37 (44), 7967-7970 (1996)]

- відновленням похідних 2-гідроксііміно-3-гідроксифенілпропіонової кислоти [Boukhris, S. et al., *Tetrahedron Lett.* 40 (9), 1669-1672 (1999)]

- розщепленням похідних N-бензилфенілсерину [Caddick, S.; *Tetrahedron*, 57 (30), 6615-6626 (2001)]

- відновленням похідних 2-діазо-3-кетифенілпропіонової кислоти [Looker, et al., *J. Org. Chem.* 22, 1233 (1957)]

- розщепленням заміщених імідазолідинонів [Davis, A. C; et al., *J. Chem. Soc.* 3479 (1951)]

$R^9=SR^{17}$.

- розкриттям кільця заміщених тіазолідинів [Nagai, U. et al., *Heterocycles* 28 (2), 589-592 (1989)]

- розкриттям кільця заміщених азиридинів з тіолами [Legters, J. et al., *Reel. Trav. Chim. Pays-Bas* 111 (1), 16-21 (1992)]

- відновленням похідних 3-кетонфеніланіну [US 4810817]

$R^9=NR^{18}R^{19}$.

- відновленням заміщених похідних 2-азидо-3-амінофеніланінів [Lee S. H., *Tetrahedron* 57 (11), 2139-2145 (2001)]

- розкриттям кільця заміщених імідазолінів [Zhou, X. T. et al., *Tetrahedron Asymmetr.* 10 (5), 855-862 (1999); Hayashi, T. et al., *Tetrahedron Lett.* 37 (28), 4969-4972 (1996)].

Необхідні для одержання похідних бензоїлу формули III бензойна кислота (похідні) формули IV можуть бути придбані на ринку або ж можуть бути одержані аналогічно відомим з літературних джерел прийомів за допомогою реакції відновлення Гриньяра з відповідного галогеніду [наприклад, A. Mannschuk et. al, *Angew. Chem.* 100, 299 (1988)].

Реакція взаємодії похідних бензоїлу формули III, де L^1 означає гідрокси, відповідно його солі, з аміном формули II з одержанням цільових заміщених бензоїлом феніланінамідів формули I здійснюється в присутності реагенту активування та, в разі потреби, у присутності основи звичайно при температурі від 0°C до точки кипіння реакційної суміші, краще від 0°C до 100°C, особливо краще при кімнатній температурі в інертному органічному розчиннику [порівн. публікації Perich, J. W., Johns, R. B., *J. Org. Chem.* 53 (17), 4103-4105 (1988); Somlai, C. et al., *Synthesis* (3), 285-287 (1992); Gupta, A. et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2*, 1911 (1990); Guan et al., *J. Comb. Chem.* 2, 297 (2000)].

Придатними реагентами активування є агенти конденсації, такі, як зв'язаний полістиролом дициклогексилкарбодіімід, діізопропілкарбодіімід, карбонілдіімідазол, складні ефіри хлорвугільної кислоти, такі, як метилхлороформіат, етилхлороформіат, ізопропілхлороформіат, ізобутилхлороформіат, втор-бутилхлороформіат або алілхлороформіат, півалоїлхлорид, поліфосфорна кислота, ангідрид пропанфосфорової кислоти, біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)-фосфорилхлорид (BOPCI) або сульфонілхлориди, такі, як метансульфонілхлорид, толуолсульфонілхлорид або бензолсульфонілхлорид.

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C_5 - C_8 -алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран (THF), нітрили, такі, як ацетонітрил і пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метил етил кетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, а також диметилсульфоксид, диметилформамід (DMF), диметилацетамід (DMA) і N-метилпіролідон (NMP) або ж вода, особливо кращі метиленхлорид, THF і вода. Можуть також застосовуватися суміші названих розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію й оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, триетиламін, етилдіізопропіамін, N-метилморфолін та піридин.

Основи загалом застосовуються в каталітичних кількостях. Вони можуть також застосовуватися еквімолярно, у надлишку або, в разі потреби, як розчинник.

Вихідні продукти загалом вводять у взаємодію один з одним в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування сполуки II у надлишку в перерахунку на сполуку III.

Переробку та виділення продуктів можна здійснювати відомим самим по собі чином.

Реакція взаємодії похідних бензоїлу формули III, де L^1 означає C_1 - C_6 -алкокси з аміном формули II з одержанням цільових заміщених бензоїлом феніланінамідів формули I здійснюється звичайно при температурі від 0°C до точки кипіння реакційної суміші, краще від 0°C до 100°C, особливо краще при кімнатній температурі в інертному органічному розчиннику, в разі потреби, у присутності основи [порівн. Kawahata, N. H. et al., *Tetrahedron Lett.* 43 (40), 7221-7223 (2002); Takahashi, K. et al., *J. Org. Chem.* 50 (18), 3414-3415 (1985); Lee, Y. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 121 (36), 8407-8408 (1999)].

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C_5 - C_8 -алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- та п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір,

діоксан, анізол і тетрагідрофуран (THF), нітрили, такі, як ацетонітрил та пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, спирти, такі, як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропанол, н-бутанол та трет-бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід (DMF), диметилацетамід (DMA) і N-метилпіролідон (NMP) або ж вода, особливо кращі метиленхлорид, THF, метанол, етанол і вода.

Можуть застосовуватися також і суміші наведених розчинників.

Взаємодію можна здійснювати, в разі потреби, у присутності основи. Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію та оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, триетиламін, етилдіізопропіламін, N-метилморфолін та піридин.

Основи загалом застосовуються в каталітичних кількостях. Вони можуть також застосовуватися еквімолярно, у надлишку або, в разі потреби, як розчинник.

Вихідні продукти застосовуються загалом в еквімолярних кількостях один з одним. Може бути сприятливим застосування сполуки II у надлишку, у перерахунку на сполуку III.

Переробку та виділення продуктів можна здійснювати відомим самим по собі чином.

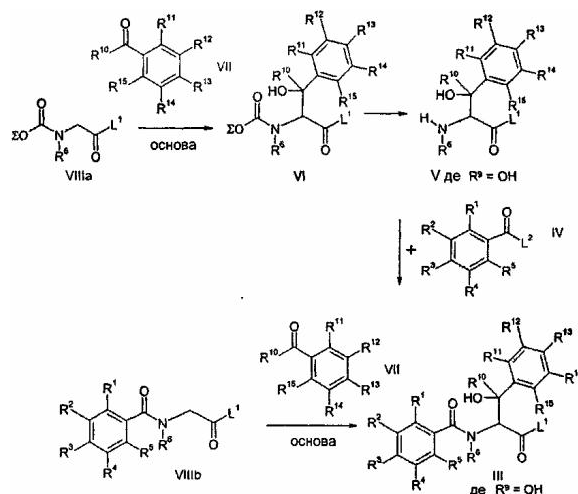
Необхідні для одержання заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули II аміни формули II можуть бути придбані на ринку.

Спосіб B

Похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, можуть бути одержані таким чином, що ациловані похідні гліцину формули VIII, де ацильна група може бути захисною групою, що відщеплюється, такою, як бензилоксикарбоніл (порівн. сполуку VIIIa з Σ бензил) або трет-бутилоксикарбоніл (порівн. сполуку VIII з Σ трет-бутил), конденсуються гетероциклікарбонільними сполуками VII до відповідних альдольних продуктів VI. Потім відщеплюється захисна група й одержаний у такий спосіб фенілаланін формули V, де R^9 означає гідроксі, ацилюється гетеробензойною кислотою (похідними) формули IV.

Аналогічно також й ациловану похідну гліцину формули VII, причому ацилгрупа являє собою заміщений гетероароїльний залишок (порівн.

сполуку VIIIb), при впливі основи можна піддавати взаємодії з гетероциклікарбонільною сполукою VII з одержанням похідної бензоїлу формули III, де R^9 означає гідроксі



L^1 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксі або C_1 - C_6 -алкокси.

L^2 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксі, галоген, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 -алкілсульфоніл, фосфорил або ізоуреїл.

Взаємодія похідних гліцину формули VIII з гетероциклікарбонільними сполуками формули VII з одержанням відповідного альдольного продукту VI, відповідно, похідної бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, здійснюється звичайно при температурі від -100°C до точки кипіння реакційної суміші, краще, від -80°C до 20°C , зокрема від -80°C до -20°C , в інертному органічному розчиннику в присутності основи [порівн. J. F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)].

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C_1 - C_6 -алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксиліл, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, а також диметилсульфоксид, диметилформамід, диметилацетамід особливо кращі діетиловий ефір, діоксан та тетрагідрофуран.

Можуть застосовуватися також і суміші названих розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідриди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, азиди лужних металів, такі, як гексаметилдизилацид літію, металоорганічні сполуки, зокрема, алкіли лужних металів, такі, як метиллітій, бутиллітій та феніллітій, а також алкогляти лужних та лужноземельних металів, такі, як метанолят натрію, етаноліт натрію, етаноліт калію, трет-бутанолят калію, трет-пентанолят калію та диметоксимагній, крім того,

органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідрид натрію, гексаметилдизилацид літію та діізопропілетиламін літію.

Основи застосовуються загалом в еквімолярних кількостях, вони можуть також застосовуватися в каталітичних кількостях, у надлишку або, в разі потреби, як розчинники.

Вихідні продукти можна піддавати взаємодії один з одним в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування основ і/або гетероциклікарбонільних сполук формули VII у надлишку в перерахунку на похідні гліцину формули VIII.

Переробку та виділення продуктів можна здійснювати відомим самим по собі чином.

Необхідні для одержання сполук I похідні гліцину формули VIII можуть бути придбані на ринку та відомі з літературних джерел [наприклад, з H. Pessoa-Mahana et al., Synth. Comm. 32, 1437 (2002)] або можуть бути одержані відповідно до цитованих літературних джерел.

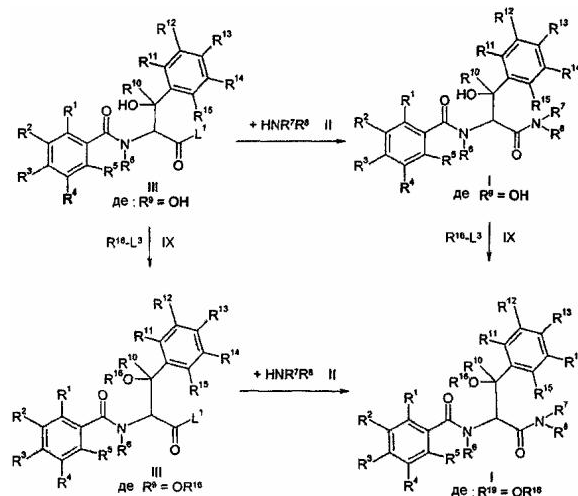
Відщиплення захисної групи з одержанням фенілаланінів формули V, де R^9 означає гідрокси, здійснюється відомими з літературних джерел методами [порівн. J. F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998); J. M. Andres, Tetrahedron 56, 1523 (2000)]; у випадку, якщо Σ означає бензил, за допомогою гідрогенлізу, бажано воднем та Pd/C у метанолі; у випадку, якщо Σ означає трет-бутил, за допомогою кислоти, краще соляної кислоти в діоксані.

Взаємодія фенілаланінів формули V, де R^9 означає гідрокси з бензойною кислотою (похідними) IV з одержанням похідних бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, здійснюється звичайно аналогічно наведеній в А взаємодії фенілаланінів формули V з бензойною кислотою (похідними) формули III з одержанням похідних бензоїлу III.

Похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, піддаються потім взаємодії з амінами формули II аналогічно способу А з одержанням цільових заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, де R^9 означає гідроксі, які потім можна дериватизувати зі сполуками формули IX у заміщених бензоїлу фенілаланінамідів формули I, де $R^9=OR^{16}$ [порівн., наприклад, публікації Yokokawa, F. et al., Tetrahedron Lett. 42 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., Tetrahedron Lett. 43 (22), 4041-4044 (2002)].

Похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, можна спочатку дериватизувати зі сполуками формули IX у подальші похідні бензоїлу формули III [порівн., наприклад, Troast, D. et al., Org. Lett. 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., Tetrahedron Lett., 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., Liebigs Ann. Chem. 565 (1987)] і потім аналогічно способу А піддавати взаємодії з амінами формули II з одержання цільових

заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, де $R^9=OR^{16}$.



L^1 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксі або C_1 - C_6 -алкокси.

L^3 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад галоген, гідроксі або C_1 - C_6 -алкокси.

Взаємодія похідних бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, відповідно, OR^{16} з амінами формули II з одержанням заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, де R^9 означає гідрокси, відповідно, OR^{16} звичайно здійснюється аналогічно описаній в А реакції взаємодії похідних бензоїлу формули III з амінами формули II.

Взаємодія похідних бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, відповідно, заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, де R^9 означає гідрокси, зі сполуками формули IX з одержанням похідних бензоїлу формули III, де $R^9=OR^{16}$, відповідно, заміщених бензоїлом фенілаланінамідів формули I, де $R^9=OR^{16}$, здійснюється звичайно при температурі від 0°C до 100°C , краще, від 10°C до 50°C , в інертному органічному розчиннику в присутності основи [порівн., наприклад, публікації Troast, D. et al., Org. Lett. 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., Tetrahedron Lett., 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., Liebigs Ann. Chem. 565 (1987)].

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C_5 - C_8 -алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, нітрили, такі, як ацетонітрил та пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, спирти, такі, як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропанол, н-бутанол та трет-бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід, диметилацетамід, особливо кращі дихлорметан, трет-бутилметиловий ефір, діоксан та тетрагідрофуран. Можуть

застосовуватися також і суміші наведених розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію та оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, амідні лужних металів, такі, як амід літію, амід натрію та амід калію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі, як гідрокарбонат натрію, металоорганічні сполуки, зокрема, алкіли лужних металів, такі, як метиллітій, бутиллітій і феніллітій, а також алкоголяти лужних і лужноземельних металів, такі, як метанолат натрію, етанолат натрію, етанолат калію, трет-бутанолат калію, трет-пентанолат калію та диметоксимагній, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін, і N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, гідрид натрію та триетиламін.

Основи загалом застосовуються в еквімолярних кількостях. Вони можуть також застосовуватися каталітично, у надлишку або, в разі потреби, як розчинник.

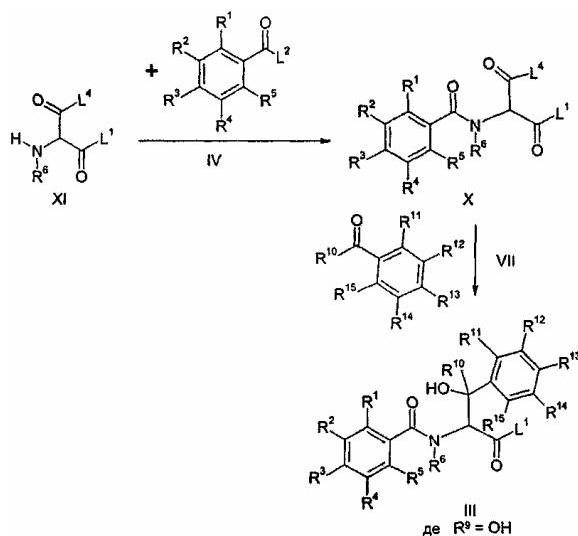
Вихідні продукти піддаються взаємодії один з одним загалом в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування основи і/або сполуки IX у надлишку, у перерахунку на сполуку III, відповідно, I.

Переробку та виділення продуктів можна здійснювати відомим самим по собі чином.

Необхідні для одержання сполуки формули VII сполуки можуть бути придбані на ринку.

Спосіб С

Похідні бензойлу формули III, де R⁹ означає гідрокси, можуть бути одержані таким чином, що аміномалоніл-сполуки формули XI спочатку ацетилюються бензойною кислотою (похідними) формули IV у відповідні N-ациламіномалоніл-сполуки формули X і потім конденсуються з гетероциклікарбонільною сполукою формули VII при декарбоксилуванні:



L¹ означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид або C₁-C₆-алкокси.

L² означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид, галоген, C₁-C₆-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, форсфорил або ізоурейл.

L⁴ означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид або C₁-C₆-алкокси.

Алкилування сполук аміномалонілу формули XI бензойною кислотою (похідними) формули V у відповідні сполуки N-ациламіномалонілу формули X звичайно здійснюється аналогічно до наведеної в способі А реакції взаємодії феніламінів формули V з бензойною кислотою (похідними) формули IV з одержанням відповідних похідних бензойлу формули III.

Взаємодія сполук N-ациламіномалонілу формули X з гетероциклікарбонільними сполуками формули VII з одержанням похідних гетероароїлу формули III, де R⁹ означає гідрокси, здійснюється звичайно при температурі від 0°C до 100°C, краще, від 10°C до 50°C, в інертному органічному розчиннику в присутності основи [див. наприклад, US 4904674; Hellmann, H. et al., Liebig's Ann. Chem. 631, 175-179 (1960)]

У тому випадку, якщо L⁴ у сполуках N-ациламіномалонілу формули X означає C₁-C₆-алкокси, доцільно спочатку переводити L⁴ шляхом омилення складного ефіру [наприклад, згідно з Hellmann, H. et al., Liebig's Ann. Chem. 631, 175-179 (1960)] у гідроксигрупу.

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C₅-C₈-алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як бензол, толуол, о-, м- і п-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі, як метиленхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, нітрили, такі, як ацетонітрил та пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон і трет-бутилметилкетон, спирти, такі, як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропанол, н-бутанол і трет-

бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід, диметилацетамід, особливо кращі діетиловий ефір, діоксан та тетрагідрофуран.

Можуть застосовуватися також і суміші наведених розчинників.

Як основи придатні в основному неорганічні сполуки, такі, як гідроксиди лужних та лужноземельних металів, такі, як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію та гідроксид кальцію, оксиди лужних і лужноземельних металів, такі, як оксид літію, оксид натрію, оксид кальцію й оксид магнію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі, як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію та гідрид кальцію, амідни лужних металів, такі, як амід літію, амід натрію та амід калію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі, як карбонат літію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі як гідрокарбонат натрію, металоорганічні, сполуки, зокрема, алкіли лужних металів, такі, як метиллітій, бутиллітій і феніллітій, а також алкоголяти лужних і лужноземельних металів, такі як метанол натрію, етанол натрію, етанол калію, трет-бутанол калію, трет-пентанол калію та диметоксимагній, крім того, органічні основи, наприклад, третинні аміни, такі, як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін, N-метилморфолін та N-метилпіперидин, піридин, заміщені піридини, такі, як колідин, літидин та 4-диметиламінопіридин, також біциклічні аміни. Особливо кращі гідроксид натрію, діізопропілетиламін та триетиламін.

Основи загалом застосовуються в каталітичних кількостях. Вони можуть також застосовуватися еквімолярно, у надлишку або, в разі потреби, як розчинник.

Вихідні продукти вводять у взаємодію один з одним загалом в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування основи в надлишку, у перерахунок на сполуку X.

Переробка й виділення продуктів може здійснюватися відомим самим по собі чином.

Одержані в такий спосіб похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси, можуть перетворюватися відповідно до способів A, відповідно, в цільові заміщені гетбензоїлом фенілаланінаміди формули I, де R^9 означає OR^{16} .

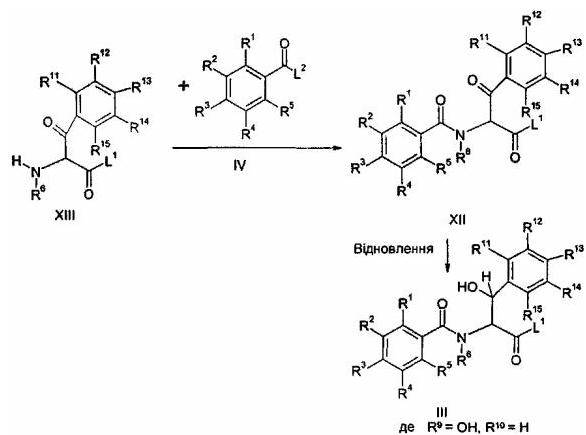
Необхідні сполуки аміномалонілу формули XI можуть бути придбані на ринку, відповідно, відомі з літературних джерел [наприклад, US 4904674; Hellmann, H. et al., Liebigs Ann. Chem. 631, 175-179 (1960)] або можуть бути одержані відповідно до цитованих літературних джерел.

Необхідні гетероциклічні сполуки формули VII можуть бути придбані на ринку.

Спосіб D

Похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси та R^{10} означає водень, можуть бути одержані таким чином, що кетосполуки формули XIII спочатку ацилюють бензойною кислотою (похідними) IV у відповідні N-ацилкетосполуки формули XII і потім відновлюють кетогрупу [Girard A, Tetrahedron Lett. 37 (44), 7967-7970 (1996); Nojori R., J. Am. Chem. Soc. 111 (25), 9134-9135

(1989); Schmidt U., Synthesis (12), 1248-1254 (1992); Bolhofer, A.; J. Am. Chem. Soc. 75, 4469 (1953)]:



L^1 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид або C_1-C_6 -алкокси.

L^2 означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксид, галоген, C_1-C_6 -алкілкарбоніл, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, фосфорил або ізоуреїл.

Ацилювання кетосполук формули XIII бензойною кислотою (похідними) формули IV в N-ацилкетосполуки формули XII звичайно здійснюється аналогічно до наведеної у способі A взаємодії фенілаланінів формули V з бензойною кислотою (похідними) формули IV з одержанням відповідних похідних бензоїлу формули III.

Необхідні для одержання похідних бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси та R^{10} означає водень, кетосполуки формули XIII відомі з літературних джерел [WO 02/083111; Boto, A. et al., Tetrahedron Letters 39 (44), 8167-8170 (1988); von Geldern, T. et al., J. of Med. Chem. 39(4), 957-967 (1996); Singh, J. et al., Tetrahedron Letters 34 (2), 211-214 (1993); ES 2021557; Maeda, S. et al., Chem. & Pharm. Bull. 32 (7), 2536-2543 (1984); Ito, S. et al., J. of Biol. Chem. 256 (15), 7834-7838 (1981); Vinograd, L. et al., Zhurnal Organicheskoi Khimii 16 (12), 2594-2599 (1980); Castro, Vinograd, L. et al., Zhurnal Organicheskoi Khimii 16 (12), 2594-2599 (1980); Castro, A. et al., J. Org. Chem. 35 (8), 2815-2816 (1970); JP 02-172956; Suzuki, M. et al., J. Org. Chem. 38 (20), 3571-3575 (1973); Suzuki, M. et al., Synthetic Communications 2 (4), 237-242 (1972)] або можуть бути одержані відповідно до цитованих літературних джерел.

Відновлення N-ацилкетосполук формули XII у похідні бензоїлу формули III, де R^9 означає гідрокси та R^{10} означає водень, здійснюється звичайно при температурі від $0^\circ C$ до $100^\circ C$, краще, від $20^\circ C$ до $80^\circ C$, в інертному органічному розчиннику в присутності агента відновлення.

Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі, як пентан, гексан, циклогексан та суміші C_5-C_8 -алканів, ароматичні вуглеводні, такі, як толуол, о-, м- і п-ксиліл, галогеновані вуглеводні, такі, як метилхлорид, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі, як діетиловий ефір,

діізопропіловий ефір, трет-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, нітрили, такі, як ацетонітрил і пропіонітрил, кетони, такі, як ацетон, метилетилкетон, діетилкетон і трет-бутилметиловий кетон, спирти, такі, як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропанол, н-бутанол та трет-бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід і диметилацетамід, особливо кращі толуол, метиленхлорид або трет-бутилметиловий ефір.

Можуть застосовуватися суміші наведених розчинників.

Як агент відновлення придатні, наприклад, боргідрид натрію, боргідрид цинку, ціаноборгідрид натрію, триетилборгідрид літію (Superhydrid®), три-втор-бутилборгідрид літію (L-Selectrid®), літійалюмінійгідрид або боран [порівн., наприклад WO 00/20424; Marchi, C. et al., Tetrahedron 58 (28), 5699 (2002); Blank, S. et al., Liebigs Ann. Chem. (8), 889-896 (1993); Kuwano, R. et al., J. Org. Chem. 63 (10), 3499-3503 (1998); Clariana, J. et al., Tetrahedron 55 (23), 7331-7344 (1999)].

Відновлення можна також здійснювати в присутності водню та каталізатора. Як каталізатор придатні, наприклад [Ru(BINAP)Cl₂] або Pd/C [порівн. Noyori, R. et al., J. Am. Chem. Soc. 111 (25), 9134-9135 (1989); Bolhofer, A. et al., J. Am. Chem. Soc. 75, 4469 (1953)].

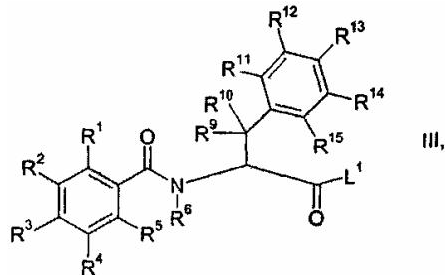
Поряд із цим відновлення можна здійснювати також й у присутності мікроорганізму. Як мікроорганізм придатний, наприклад, *Saccharomyces Rouxii* [порівн. Soukup, M. et al., Helv. Chim. Acta 70, 232 (1987)].

N-ацилкетосполуки формули XII і відповідний агент відновлення загалом вводять у взаємордію один з одним в еквімолярних кількостях. Може бути сприятливим застосування агента відновлення в надлишку, у перерахунок на сполуку формули XII.

Переробка та виділення продуктів здійснюється відомим чином.

Одержані в такий спосіб похідні бензоїлу формули III, де R⁹ означає гідрокси та R¹⁰ означає водень, можуть потім перетворюватися відповідно до вищенаведеного способу А та В у цільові заміщені бензоїлом фенолаланінаміди I, де R⁴=OR¹¹.

Похідні бензоїлу формули III



причому R¹-R⁶ та R⁹-R¹⁵ мають наведені в п.1 значення, і L¹ означає відхідну групу, яка нуклеофільно витісняється, наприклад, гідроксі або C₁-C₆-алкокси, також є об'єктом даного винаходу.

Особливо кращі форми виконання похідних бензоїлу формули III щодо змінних відповідають залишкам R¹-R⁶ та R⁹-R¹⁵ формули I.

Особливо кращі похідні бензоїлу формули III, у яких

R¹ означає фтор, хлор або CF₃,

R² та R³ незалежно один від одного означають водень, фтор або хлор,

R⁴, R⁵ та R⁶ означають водень,

R⁹ означає OR¹⁶, SR¹⁷ або NR¹⁸R¹⁹,

R¹⁰ означає водень;

R¹¹ означає водень, фтор або CH₃;

R¹² означає водень, фтор або хлор;

R¹³, R¹⁴ та R¹⁵ означають водень;

R¹⁶ та R¹⁸ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, феноламінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкіл)-N-(феніл)-амінокарбоніл, SO₂CH₃, SO₂CF₃ або SO₂(C₆H₅);

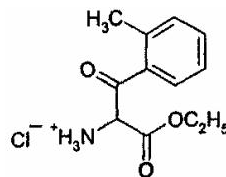
R¹⁷ означає водень, C₁-C₄-алкілкарбоніл, C₁-C₄-алкоксикарбоніл, C₁-C₄-алкіламінокарбоніл, ді-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₄-алкокси)-N-(C₁-C₄-алкіл)-амінокарбоніл; та

R¹⁹ означає водень або C₁-C₄-алкіл.

Приклад 1

Складний 2-(4-фторо-2-трифторометилбензиламіно)-2-метилкарбамоїл-1-о-толілетиловий ефір (2S,2R)-метилфенілкарбамоїлової кислоти (табл. 3. №3.34)

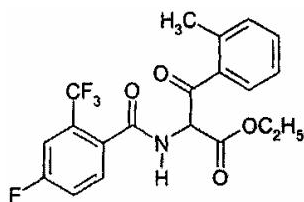
1.1) Гідрохлорид складного етилового ефіру 2-аміно-3-оксо-3-о-толіл-пропіонової кислоти



4,2г (0,038моль) трет-бутилату калію суспендують в атмосфері азоту в тетрагідрофурані. Потім його охолоджують до -78°C та додають по краплях 10,0г (0,037моль) N-(дифенілметил)-гліцинетилового ефіру, розчиненого в тетрагідрофурані. Через 40хв при -78°C розчин переводять в охолоджену краплинну ліжку (-78°C) і охолоджений до -78°C розчин додають по краплях до 2-метилбензоїлхлориду в тетрагідрофурані. Після перемішування протягом 1 години при -78°C реакційну суміш нагрівають протягом 2 годин до 0°C. Реакційну суміш гідролізують 10%-вою соляною кислотою та ще перемішують. Розчинник видаляють, залишок завантажують у воду та промивають за допомогою МТВЕ. Водну фазу концентрують, залишок змішують із метанолом та відфільтровують. Після концентрації фільтрату одержують 6,2г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвного масла.

¹H-ЯМР (ДМСО): δ = 9.3 (br, 3H, NH); 7.3-7.6 (т, 4H), 4.1 (т, 2H); 3.7 (т, 1H); 2.40 (s, 3H); 0.95 (t, 3H).

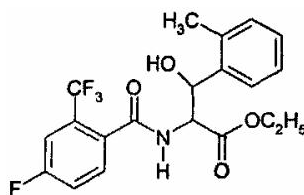
1.2) Складний етиловий ефір 2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-оксо-3-о-толілпропіонової кислоти



6,2г (0,024моль) складного етилового ефіру 2-аміно-3-оксо-3-о-толілпропіонової кислоти розчиняють у метиленхлориді та додають 9,7г (0,096моль) триетиламіну. До цієї реакційної суміші додають по краплях при 0°C 5,4г розчиненого в метиленхлориді (0,024моль) 4-фтор-2-трифторметилбензоїлхлориду. Потім реакційну суміш перемішують протягом 1 години при кімнатній температурі й потім змішують із 5%-вою соляною кислотою. Відокремлюють органічну фазу, промивають, сушать і видаляють розчинник. Після хроматографічного очищення (силікагель, циклогексан/етилацетат) одержують 4,7г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвних кристалів.

^1H -ЯМР (ДМСО): δ = 9,61 (d, 1H); 7,3-7,9 (т, 7H); 6,18 (d, 1H); 4,1-4,3 (т, 2H); 2,40 (s, 3H); 1,15 (t, 3H).

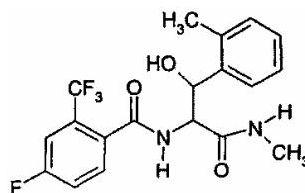
1.3) Складний етиловий ефір (2S,3R)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-гідроксі-3-о-толілпропіонової кислоти



4,7г (0,0114моль) складного етилового ефіру 2-(4-фторо-2-трифторометилу) розчиняють в метиленхлориді, з розчину видаляють газ в ультразвуковій ванні та змішують із 200млг каталізаторної суміші. До цього каталізаторну суміш одержують нагріванням протягом 1 години 78мг дихлоро(Р-цимен)рутеній(II)-димеру (RuCl_2Cy) та 138млг BINAP у метиленхлориді та етанолі до 50°C і наступним видаленням розчинника. Реакційний розчин нагрівають при 80бар тиску водню при 50°C протягом 90 годин. Після видалення розчинника та хроматографічного очищення (силікагель, циклогексан/етилацетат) одержують 3,4г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвних кристалів.

^1H -ЯМР (ДМСО) δ = 8,95 (d, 1H); 7,0-8,7 (m, 7H); 5,80 (d, 1H); 5,40 (t, 1H); 4,75 (dd, 1H); 4,10 (т, 2H); 2,30 (s, 3H); 1,20 (t, 3H).

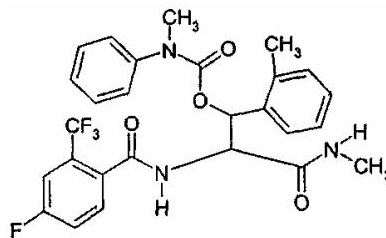
1.4) N-метиламід (2S,3R)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-гідроксі-3-о-толілпропіонової кислоти



3,4г (0,0082моль) складного етилового ефіру (2S,3R)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-гідроксі-3-о-толілпропіонової кислоти розчиняють в етанолі. При кімнатній температурі вводять газ метиламіну. Через 1,5год. нагрівають протягом 1 години до 30-35°C. Після видалення розчинника одержують 3,1г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвних кристалів.

^1H -ЯМР (ДМСО): δ = 8,45 (d, 1H); 7,0-7,7 (m, 7H); 5,70 (d, 1H); 5,30 (t, 1H); 4,65 (dd, 1H); 2,65 (d, 3H); 2,40 (s, 3H); 1,10 (t, 3H).

1.5) N-метиламід (2S,3R)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-(1N-феніл-N-метиламінокарбонілокси)-3-о-толілпропіонової кислоти (табл. 3. №3.34)



0,4г (0,001моль) N-метиламіду (2S,3R)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-гідроксі-3-о-толілпропіонової кислоти розчиняють у метиленхлориді, додають 0,13г (0,0013моль) триетиламіну та на кінчику шпателя 4-диметиламінопіридину та додають по краплях 0,22г N-феніл-N-метил-карбамоїлхлориду в метиленхлориді. Суспензію перемішують протягом 5 годин, екстрагують 5%-ою соляною кислотою й NaHCO_3 -розчином та сушать. Після хроматографічного очищення (силікагель, циклогексан/етилацетат) одержують 0,28г зазначеної в заголовку сполуки як безбарвне масло.

^1H -ЯМР (ДМСО): δ = 8,8 (br, 1H); 7,0-7,6 (m, 12H); 5,70 (d, 1H); 5,30 (br, 1H); 4,85 (dd, 1H); 2,75 (d, 3H); 2,55 (d, 3H); 2,40 (s, 3H).

Приклад 2

N-[2-(бензилформіламіно)-1-метил карбамоїл-2-фенілетил]-4-фторо-2-трифторометилбензамід (табл. 3, №3.43)

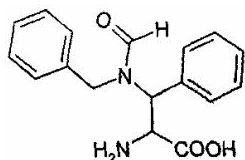
2.1) Складний етиловий ефір 1-бензил-5-феніл-4,5-дигідро-1H-імідазол-4-карбонової кислоти

25,7г (0,1305моль) бензиліденбензиламід у розчиняють в етанолі, додають по краплях 15,2 (0,1305моль) складного етилового ефіру ізоціанооцтової кислоти. Розчин нагрівають з зворотним холодильником впродовж 16 годин. Після видалення розчинника та сушіння

одержують 40,2г зазначеної в заголовку сполуки як безбарвного масла.

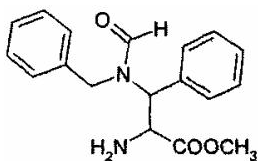
¹H-ЯМР (ДМСО): δ = 7,1-7,4 (m, 10H); 4,6 (d, 1H); 4,5 (d, 1H); 4,3 (d, 1H); 4,1(q,2H); 3,8(d, 1H); 1,1 (t, 3H).

2.2) 2-аміно-3-(N-бензил-N-форміламіно)-3-фенілпропіонова кислота



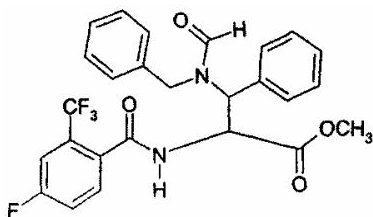
14,8г (0,048моль) складного етилового ефіру 1-бензил-5-феніл-4,5-дигідро-1Н-імідазол-4-карбонової кислоти нагрівають зі зворотним холодильником в 100мл 47%-вого НВг-розчину протягом 3 годин. Видаляють розчинник, залишок змішують з водою та фільтрують. Розчинник видаляють, залишок завантажують в етанол і розбавляють діетилацетатом. Одержану суспензію фільтрують і видаляють розчинник. Одержують 14,0г зазначеної в заголовку сполуки як сирий продукт, який без очищення застосовують на наступній стадії.

2.3) Складний метиловий ефір 2-аміно-3-(N-бензил-N-форміламіно)-3-фенілпропіонової кислоти



13,5г (0,04моль) 2-аміно-3-(N-бензил-N-форміл-аміно)-3-фенілпропіонової кислоти розчиняють у метанолі й додають по краплях 7,1г (0,06моль) тіонілхлориду та 1 краплю диметилформаміду. Через 20 годин видаляють розчинник, залишок суспендують у діетилацетаті та при перемішуванні додають 5%-вий NH_4CO_3 -розчин. Ефірну фазу відокремлюють, промивають і сушать. Після видалення розчинника одержують 4,0г зазначеної в заголовку сполуки як безбарвне масло, що застосовують без очищення на наступній стадії.

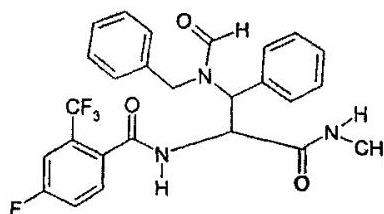
2.4) Складний метиловий ефір 3-(N-бензил-N-форміламіно)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-фенілпропіонової кислоти



1,4г (0,0052моль) складного етилового ефіру 2-аміно-3-(N-бензил-N-форміламіно)-фенілпропіонової кислоти розчиняють у метиленхлориді та додають 1,0г (0,005моль) 4-фтор-2-трифторметил-бензойної кислоти і 1,0г (0,010моль) триетиламіну в тетрагідрофурані. При 0-5°C додають 1,3г (0,0052моль) біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфорилхлориду. Через 2 години при 0°C реакційну суміш перемішують протягом 15 годин при кімнатній температурі. Видаляють розчинник, залишок завантажують в етилацетат, промивають і сушать. Після хроматографічного очищення (силікагель, циклогексан/етилацетат) одержують 0,65г зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвного масла.

¹H-ЯМР (ДМСО): δ = 8,45 (s, 1H); 7,95 (d, 1H); 7,00-7,40 (т, 13H); 5,40 -5,55 (т, 2H); 4,38 (q, 2H); 3,60 (s, 3H).

2.5) N-[2-(N-бензил-N-форміламіно)-1-метилкарбамоіл-2-фенілетил]-4-фторо-2-трифторометилбензамід (табл. 3. №3.43)

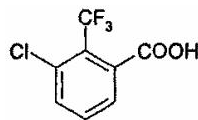


0,65г (0,00129моль) складного метилового ефіру 3-(N-бензил-N-форміл-аміно)-2-(4-фторо-2-трифторометилбензоїламіно)-3-фенілпропіонової кислоти розчиняють у метанолі. При 0°C вводять газ метиламін і реакційну суміш нагрівають протягом 1 години до кімнатної температури. Після видалення розчинника та звичайних методів очищення одержують 550мг зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвних кристалів.

¹H-ЯМР (ДМСО): δ = 9,20 (d, 1H); 8,51 (s, 1H); 8,30 (т, 1H); 6,75-7,75 (т, 12H); 5,52 (t, 1H); 5,07 (d, 1H); 4,52 (d, 1H); 4,20 (d, 1H); 2,40 (d, 3H).

Приклад 3

3-хлоро-2-трифторметилбензойна кислота.

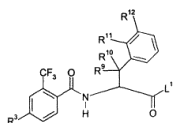


1,03г (42,4ммоль) кусочків магнію розчиняють у тетрагідрофурані. До реакційної суміші додають 2 краплі 1,2-дібромметану та реакційну суміш перемішують після початку екзотермічної реакції при 32-35°C при охолодженні льодом. Потім додають по краплях 10,0г (38,5ммоль) 1-бром-3-хлор-2-трифторметилбензолу в тетрагідрофурані таким чином, щоб температура не перевищувала 32°C. Реакційну суміш перемішують 30 хвилин, охолоджують до 0°C і в продовж 2 годин вводять діоксид вуглецю. Потім нагрівають до кімнатної температури та ще протягом 2 годин вводять CO_2 . Реакційний розчин виливають на суміш із 1М соляної кислоти та льоду і екстрагують метил-

трет-бутиловим ефіром. Органічну фазу потім екстрагують за допомогою 1М NaOH, водну фазу підкисляють концентрованою соляною кислотою і екстрагують метиленхлоридом.

Після сушіння та дистиляційного видалення розчинника одержують 7,7г (84% від теорії) зазначеної в заголовку сполуки у вигляді безбарвних кристалів (Т. пл. 110°С).

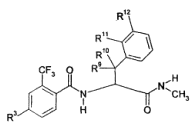
У нижченаведених таблицях 2 та 3 поряд з вищенаведеними сполуками наведені ще інші похідні бензоїлу формули III, а також заміщені бензоїлом фенілаланінаміди формули I, які одержані або можуть бути одержані аналогічно вищеописаним способам.



III, де R¹ = CF₃, R² = H, R³, R⁴, R⁵, R⁶ = H, R¹⁰ = H, R¹¹ = H

Таблиця 2

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	L ¹	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
2.1	H	OH	H	H	H	H	OCH ₃	еритро	рац	115
2.2	H	OH	H	H	H	H	OH	трео	рац	110
2.3	F	OH	H	H	H	H	OC ₂ H ₅	еритро	рац	93
2.4	F	OH	H	F	H	H	OC ₂ H ₅	трео	2-S, 3-R	96
2.5	F	OH	CH ₃	F	H	H	OC ₂ H ₅	еритро	2-S, 3-R	141
2.6	H	OH	H	H	H	H	OC ₂ H ₅	еритро	рац	93
2.7	H	OH	H	H	H	H	OCH ₃	трео	рац	114
2.8	H	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	OCH ₃	трео	рац	157
2.9	F	OH	H	CF ₃	H	H	OH	трео	рац	33
2.10	F	OH	H	OH	H	H	OC ₂ H ₅	трео	2-S, 3-R	128
№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	L ¹	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
2.11	F	OH	H	NO ₂	H	H	OCH ₃	еритро	рац	119
2.12	F	OH	H	NO ₂	H	H	OCH ₃	трео	рац	130
2.13	F	OH	H	H	CF ₃	H	OH	трео	рац	145
2.14	F	OH	Cl	H	H	H	OH	трео	рац	188
2.15	F	OH	Cl	CF ₃	H	H	OH	трео	рац	155
2.16	F	OH	Cl	Cl	H	H	OH	трео	рац	192
2.17	F	OH	Cl	H	Cl	H	OH	трео	рац	190
2.18	F	OH	Cl	H	H	Cl	OH	трео	рац	202
2.19	F	OH	OCH ₂ C ₆ H ₄	H	H	H	OC ₂ H ₅	трео	2-S, 3-R	164
2.20	F	OCOCCH ₃	Cl	H	H	H	OH	трео	рац	188
2.21	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	NO ₂	H	H	OCH ₃	трео	рац	133
2.22	F	OSi(CH ₃) ₂ Cl(CH ₃) ₂	H	H	H	H	OH	трео	рац	m/z 485
2.23	F	OSi(CH ₃) ₂ Cl(CH ₃) ₂	H	H	H	H	OCH ₃	трео	рац	114
2.24	F	NHCH ₂ C ₆ H ₄	H	H	H	H	OCH ₃	4:1	рац	масло



I, де R¹ = CF₃, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ = H, R¹⁰ = CH₃, R¹¹, R¹², R¹³ = H, R¹⁴ = H

Таблиця 3

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
3.1	H	OH	H	H	H	H	еритро	рац	154
3.2	H	OH	H	H	H	H	трео	рац	154
3.3	H	OH	CH ₃	H	H	H	трео	рац	206
3.4	H	OH	H	CH ₃	H	H	трео	рац	209
3.5	F	OH	H	H	H	H	еритро	рац	225
3.6	F	OH	H	H	H	H	трео	рац	155
3.7	F	OH	H	H	H	F	трео	2-S, 3-R	90
3.8	F	OH	CH ₃	H	H	H	трео	рац	167
3.9	F	OH	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	62
3.10	F	OH	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	41
3.11	F	OH	H	CH ₃	Cl	H	трео	2-S, 3-R	масло
3.12	H	OCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	155
№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
3.13	F	O-CH ₂ -C ₆ H ₄	H	H	H	H	трео	рац	168
3.14	H	O-CH ₂ -p-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H	H	H	трео	рац	137
3.15	H	O-CH ₂ -p-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	H	H	трео	рац	масло
3.16	F	O-CH ₂ -(2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₃)	H	H	H	H	трео	рац	180
3.17	H	OCOCCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	196
3.18	F	OCOCCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	218
3.19	F	OCOCCH ₃	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	165
3.20	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	181
3.21	H	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	еритро	рац	190
3.22	H	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	140
3.23	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	масло
3.24	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	183
3.25	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	189
3.26	H	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	еритро	рац	масло
3.27	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	120
3.28	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	масло
3.29	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	170
3.30	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	CH ₃	Cl	H	трео	2-S, 3-R	масло
3.31	F	OCOCNH(C ₆ H ₄)	H	H	H	H	трео	рац	207
3.32	F	OCOCNH(m-Cl-C ₆ H ₄)	H	H	H	H	трео	рац	200
3.33	F	OCOCNH(m-CN-C ₆ H ₄)	H	H	H	H	трео	рац	140
3.34	F	OCOCNH(C ₆ H ₄)	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	масло
3.35	F	OCOC-N-морфолін	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	масло

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
3.36	H	OCOCCH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	142
3.37	F	OCOCCH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	136
3.38	H	OSO ₂ CH ₃	H	H	H	H	трео	рац	141
3.39	F	OSO ₂ CH ₃	H	H	H	H	трео	рац	135
3.40	F	OSO ₂ CH ₃	H	CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	90
3.41	F	S-CH ₂ -C ₆ H ₄	H	CH ₃	H	H	1:1	рац	162
3.42	H	NH-C ₆ H ₄	H	H	H	H	1:1	рац	масло
3.43	F	N-(CH ₂ -C ₆ H ₄)(CHO)	H	H	H	H	еритро	рац	212
3.44	F	NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	H	4:1	рац	217
3.45	F	OH	H	H	H	H	трео	рац	203
3.46	F	OH	H	H	H	F	трео	2-S, 3-R	90
3.47	F	OH	H	H	H	Br	трео	2-S, 3-R	165
3.48	F	OH	H	H	H	CF ₃	трео	рац	161
3.49	F	OH	H	H	H	OCH ₃	трео	2-S, 3-R	188
3.50	F	OH	H	H	H	NO ₂	еритро	рац	m/z 429
3.51	F	OH	H	H	H	NO ₂	трео	рац	207
3.52	F	OH	H	H	H	C ₂ H ₅	трео	рац	198
3.53	F	OH	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	трео	рац	183
3.54	F	OH	H	H	H	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃	трео	рац	202
3.55	F	OH	H	H	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	трео	рац	198
3.56	F	OH	H	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	трео	рац	177
3.57	F	OH	H	H	H	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	трео	рац	185
3.58	F	OH	H	H	H	4-Cl-2-пеніл	трео	рац	133

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
3.59	F	OH	H	Cl	H	H	трео	рац	172
3.60	F	OH	H	CF ₃	H	H	трео	рац	142
3.61	F	OH	H	CH ₂ OH	H	H	трео	2-S, 3-R	152
3.62	F	OH	H	CH ₂ OCOCCH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 458
3.63	F	OH	H	CH ₂ OCOCCH ₂ COOH	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 472
3.64	F	OH	H	CH ₂ OCOCNSO ₂ CF ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 589
3.65	F	OH	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	97
3.66	F	OH	H	OCH ₂ C ₆ H ₄	H	H	трео	2-S, 3-R	150
3.67	F	OH	H	NO ₂	H	H	трео	рац	m/z 429
3.68	F	OH	H	NH ₂	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 389
3.69	F	OH	H	NHCOCH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 441
3.70	F	OH	H	NHSO ₂ CH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 477
3.71	F	OH	H	NHSO ₂ CF ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 531
3.72	F	OH	H	Cl	CF ₃	H	трео	рац	172
3.73	NHCH ₃	OH	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	131
3.74	F	OCOCCH ₃	H	Cl	H	H	трео	рац	145
3.75	F	OCOCCH ₃	H	H	F	H	трео	рац	161
3.76	F	OCOCCH ₃	H	H	H	CF ₃	трео	рац	176
3.77	F	OCOCCH ₃	H	Cl	Cl	H	трео	рац	200
3.78	F	OCOCCH ₃	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	138
3.79	F	OCOCCH ₃	H	Cl	CF ₃	H	трео	рац	215
3.80	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	F	H	еритро	рац	m/z 468
3.81	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	F	H	трео	2-S, 3-R	185

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	еритро/ трео	Конфігу- рація	Тпл. відпов. m/z
3.82	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	Br	H	трео	2-S, 3-R	142
3.83	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	Cl	Cl	H	трео	рац	185
3.84	F	OCOCCH=CH ₂	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	187
3.85	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	m/z 452
3.86	F	OCOC(CH ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	m/z 466
3.87	F	OCOCCH ₂ Cl	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	158
3.88	F	OCOCCH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	m/z 456
3.89	F	OCOCCH ₂ OCH ₃	H	H	F	H	трео	2-S, 3-R	185
3.90	F	OCOCCH ₂ SCCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	160
3.91	F	OCOCCH ₂ SCCH ₃	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	134
3.92	F	OCOCCH ₂ CH ₂ (OH)COOH	H	CH ₃	F	H	трео	2-S, 3-R	m/z 532
3.93	F	OCOCCH ₂ CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	m/z 512
3.94	F	OCOCCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	трео	рац	m/z 544
3.95	F	OCOCCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	Cl	Cl	H	трео	рац	m/z 613
3.96	F	OCOCCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ OCOCCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	трео	2-S, 3-R	m/z 734
3.97	F	OCOC(4-CN-C ₆ H ₄) ₂	H	H	H	H	трео	рац	212
3.98	F	OCOC(2,5-Cl ₂ -6-OCH ₃ -C ₆ H ₃) ₂	H	H	H	H	трео	рац	220
3.99	F	OCOCCH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	H	H	трео	рац	m/z 502
3.100	F	OCOCCH ₃ (2-F-C ₆ H ₄)	H	H	H	H	трео	рац	m/z 520
3.101	F	OCOCCH ₃ (4-F-C ₆ H ₄)	H	H	H	H	трео	рац	m/z 520
3.102	F	OCOCCH ₃ (2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	H	H	H	H	трео	рац	m/z 571
3.103	F	OCOCCH ₃ (2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	H	H	H	H	трео	рац	m/z 571

№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	епітроп трепо	Конфі- рація	Тпн. відпо- вiз
5.1	F	H	F	H	H	трепо	рацi	m/z 334
5.2	F	H	CF ₃	H	H	трепо	рацi	m/z 384
5.3	F	H	H	F	H	трепо	рацi	m/z 334
№	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	епітроп трепо	Конфі- рація	Тпн. відпо- вiз
5.4	F	H	H	H	F	трепо	рацi	m/z 334
5.5	F	H	H	H	Cl	трепо	рацi	m/z 350
5.6	F	F	H	H	H	трепо	рацi	m/z 352
5.7	F	F	H	F	F	трепо	рацi	m/z 370
5.8	Cl	H	H	H	H	трепо	рацi	m/z 332
5.9	Cl	H	H	H	H	трепо	рацi	m/z 367
5.10	Cl	CF ₃	H	H	H	трепо	рацi	167
5.11	Cl	NO ₂	H	H	H	трепо	рацi	m/z 377
5.12	H	H	Cl	H	H	трепо	рацi	m/z 367
5.13	Cl	H	NO ₂	H	H	трепо	рацi	m/z 377
5.14	Cl	H	H	Cl	H	трепо	рацi	m/z 367
5.15	Cl	H	Cl	Cl	H	трепо	рацi	m/z 401
5.16	Cl	H	COOCH ₃	Cl	H	трепо	рацi	m/z 425
5.17	Cl	NO ₂	Cl	NO ₂	H	трепо	рацi	m/z 457
5.18	CH ₃	H	H	H	H	трепо	рацi	m/z 312
5.19	CH ₃	C(CH ₃)(CH ₃)	H	H	H	трепо	рацi	m/z 355
5.20	CH ₃	NO ₂	H	H	H	трепо	рацi	m/z 357
5.21	CH ₃	H	H	H	CH ₃	трепо	рацi	m/z 326
5.22	CH ₃	H	H	H	NO ₂	трепо	рацi	m/z 357
5.23	CH ₃	NO ₂	H	NO ₂	H	трепо	рацi	m/z 402
5.24	CF ₃	F	H	H	H	трепо	рацi	158
5.25	CF ₃	Cl	H	H	H	трепо	рацi	m/z 400
5.26	NO ₂	H	H	H	H	трепо	рацi	m/z 343
5.27	NO ₂	Cl	H	H	H	трепо	рацi	m/z 377

застосовуватися шляхом обприскування, дрібнокапельного обприскування, обпилювання, опудрювання або поливу. Технологія обробки та використовувані форми залежать від мети застосування, але у всіх випадках повинен бути забезпечений максимально тонкий та рівномірний розподіл сумішей за винаходом.

Гербіцидні засоби містять гербіцидно активну кількість, принаймні, однієї сполуки формули I або застосовної в сільському господарстві солі сполуки формули I та звичайні для препаративних форм засобів захисту рослин допоміжні засоби.

Як інертні допоміжні засоби придатні в основному: фракції мінеральних масел з середньою - високою точками кипіння, такі, як гас або дизельне масло, далі кам'яновугільні масла, а також масла (олії) рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні та ароматичні вуглеводні, наприклад, парафіни, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни та їх похідні, алкіловані безоли та їх похідні, спирти, такі, як метанол, етанол, пропанол, бутанол та циклогексанол, кетони, такі, як циклогексанон, сильно полярні розчинники, наприклад, аміни, такі, як N-метилпіролідон та вода.

Водні форми застосування можна приготувати з концентратів емульсій, суспензій, паст, змочувальних порошків або гранулятів, що диспергуються у воді, шляхом додавання води. Для одержання емульсій, паст або масляних дисперсій субстрати як такі або розчинені в маслі або розчиннику можна гомогенізувати у воді за допомогою агента змочування, адгезії, диспергування або емульгування. Також можна приготувати концентрати, що придатні для розведення водою, які складаються з діючих речовин і змочувальних агентів, адгезійних складів, диспергаторів або емульгаторів, і, можливо, розчинників або масла.

Як поверхнево-активні речовини придатні лужні, лужноземельні, амонієві солі ароматичних сульфокислот, наприклад, лінгнінсульфокислоти, фенолсульфокислоти, нафталінсульфокислоти, дибутилнафталінсульфокислоти, а також кислот жирного ряду, алкілсульфонатів та алкіларилсульфонатів, алкілсульфатів, лаурилефірсульфатів і сульфатів спиртів жирного ряду, а також солі сульфатованих гекса-, гепта- і октадеканолей або глікольефірів спирту жирного ряду, продукти конденсації сульфонованого нафталіну або його похідних з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну, відповідно нафталінсульфокислот з фенолом або формальдегідом, поліоксіетилен-октилфенольний ефір, етоксирований ізооктил-, октил- або нонілфенол, алкілфенол- або трибутилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, ізотридециловий спирт, конденсати жирного спирту/окису етилену, етоксирована рицинова олія, поліоксіетиленалкіловий ефір або поліоксипропілен, поліглікольефірний ацетат лаурилових спиртів, складний ефір сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луги або метилцелюлоза.

Порошок, препарат для розпилення та опудрювання можна одержати за допомогою змішування або спільного розмелу діючих речовин із твердими наповнювачами.

Грануляти, наприклад покриті, просочені або гомогенні, одержують звичайно за допомогою сполучення діючої речовини або діючих речовин із твердим наповнювачем. Як тверді носії, використовують, наприклад, мінеральні землі, такі, як силікагель, кремнієві кислоти, силікати, тальк, каолін, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію, розмелені пластмаси, а також такі добрива, як сульфати амонію, фосфати амонію, нітрати амонію, сечовини та рослинні продукти, такі, як, наприклад, борошно зернових культур, борошно деревної кори, деревне борошно та борошно горіхової шкарлупи, целюлозний порошок або інші тверді наповнювачі.

Концентрації сполук формули I у готових до застосування препаративних формах можуть варіюватися в широких межах. Загалом препаративні форми містять приблизно від 0,001 до 98мас.%, переважно 0,01 до 95мас.%, принаймні однієї діючої речовини. Діючі речовини застосовуються при цьому із чистотою від 90% до 100%, краще, від 95% до 100% (за спектром ЯМР).

Нижченаведені приклади препаративних форм пояснюють одержання таких композицій:

Приклади препаративних форм:

I. 20 масових частин діючої речовини формули I розчиняють у суміші, що складається з 80 масових частин алкілованого бензолу, 10 масових частин продукту приєднання від 8 до 10 моль етиленоксиду до 1 моль N-моноетаноламідів олеїнової кислоти, 5 масових частин кальцієвої солі додецилбензолсульфокислоти та 5 масових частин продукту приєднання 40 моль етиленоксиду до 1 моль рицинової олії. Виливанням розчину в 100000 масових частин води та тонким розподіленням одержують водну дисперсію, яка містить 0,02мас.% діючої речовини формули I.

II. 20 масових частин діючої речовини формули I розчиняють у суміші, що містить 40 масових частин циклогексанону, 30 масових частин ізобутанолу, 20 масових частин продукту приєднання 7 моль етиленоксиду до 1 моль ізооктилфенолу та 10 масових частин продукту приєднання 40 моль етиленоксиду до 1 моль рицинової олії. Виливанням розчину в 100000 масових частин води та тонким розподіленням одержують водну дисперсію, що містить 0,02мас.% діючої речовини формули I.

III. 20 масових частин діючої речовини формули I розчиняють у суміші, що містить 25 масових частин циклогексанону, 65 масових частин фракції мінерального масла із точкою кипіння від 210 до 280°C та 10 масових частин продукту приєднання 40 моль етиленоксиду до 1 моль рицинової олії. Виливанням розчину в 100000 масових частин води та тонким розподіленням одержують водну дисперсію, яка містить 0,02мас.% діючої речовини формули I.

IV. 20 масових частин діючої речовини формули I добре змішують з 3 масовими частинами натрієвої солі діізобутилнафталінсульфокислоти, 17 масовими частинами натрієвої солі лігнінсульфокислоти із сульфатного відпрацьованого луку та 60 масовими частинами порошкоподібного силікагелю та перемелюють у молотковому млині. Тонким розподіленням суміші в 20000 масових частин води одержують розчин для обприскування, що містить 0,1мас.% діючої речовини формули I.

V. 3 масових частин діючої речовини формули I змішують із 97 масовими частинами тонкого каоліну, у такий спосіб одержують засіб для розпилення, який містить 3мас.% діючої речовини формули I.

VI. 20 масових частин діючої речовини формули I ретельно перемішують із 2 масовими частинами кальцієвої солі додецилбензолсульфокислоти, 8 масовими частинами простого полігліколевого ефіру спиртів жирного ряду, 2 масовими частинами натрієвої солі конденсату фенолу, сечовини та формальдегіду та 68 масовими частинами парафінового мінерального масла. Одержують стабільну масляну дисперсію.

VII. 1 масову частину діючої речовини формули I розчиняють у суміші, що складається з 70 масових частин циклогексанону, 20 масових частин етоксированого ізооктилфенону та 10 масових частин етоксированої рицинової олії. Одержують стабільний емульсійний концентрат.

VIII. 1 масову частину діючої речовини формули I розчиняють у суміші, що складається з 80 масових частин циклогексанону та 20 масових частин Wettol^R EM 31 (неіоногенного емульгатора на базі етоксированої рицинової олії). Одержують стабільний емульсійний концентрат.

Нанесення сполук формули I, відповідно, гербіцидного засобу може здійснюватися досходовим або післясходовим способом. Якщо діючі речовини гірше переносяться певними культурними рослинами, то можуть застосовуватися техніки нанесення, при яких гербіцидний засіб розприскується за допомогою розприскувальних пристроїв таким чином, що листя чутливих культурних рослин по можливості не піддаються обприскуванню, у той час, як діючі речовини попадають на листя зростаючих під ними небажаних рослин або на непокритий ґрунт, (метод спрямованого обприскування, відповідно, метод стрічкового обприскування).

Норми витрати сполуки формули I, залежно від мети обробки, пори року та стадії росту, становлять від 0,001 до 3,0, краще, від 0,01 до 1,0кг/га активної речовини (а.р.).

Для розширення спектра дії та одержання синергічного ефекту заміщені гетероароліом фенілаланінаміди формули I можна змішувати та спільно вносити з численними представниками інших гербіцидних і регулюючих ріст груп діючих речовин. Як додаткові компоненти суміші придатні, наприклад, 1,2,4-тіадіазоли, 1,3,4-тіадіазоли, аміді, амінофосфорна кислота та її похідні, аміотриазоли, аніліди, арилоксі-

/гетероарилоксіалканові кислоти та їх похідні, бензойна кислота та її похідні, бензотіадіазинони, 2-(гетароліл/ароліл)-1,3-циклогександіони, гетероариларилкетони, бензилізоксазолідинони, мета-CF₃-фенілпохідні, карбамати, хінолінкарбонова кислота та її похідні, хлорацетаніліди, похідні циклогексеноноксимефіру, діазини, дихлорпропіонова кислота та її похідні, дигідробензофурані, дигідрофуран-3-они, динітроаніліни, динітрофеноли, простий дифеніловий ефір, дипіридили, галогенкарбонові кислоти та їх похідні, сечовини, 3-фенілурацили, імідазоли, імідазолініони, N-феніл-3,4,5,6-тетрагідрофталіміди, оксадіазоли, оксирані, феноли, складні ефіри арилоксі- і гетероарилоксифеноксипропіонової кислоти, фенілоцтова кислота та її похідні, 2-фенілпропіонова кислота та її похідні, піразоли, фенілпіразоли, піридазини, піридинкарбонова кислота та її похідні, простий піримідиловий ефір, сульфонаміди, сульфонілмочевини, триазини, триазинони, триазолініони, триазолкарбоксаміді та урацили.

Крім того, корисним може бути застосування одних сполук формули I або в комбінації з іншими гербіцидами також у суміші ще з іншими засобами захисту рослин, наприклад, із засобами для боротьби зі шкідниками або фітопатогенними грибами, відповідно, бактеріями. Далі становлять інтерес суміші з розчинами мінеральних масел, які застосовуються для запобігання недостатності поживних речовин і мікроелементів. Також можуть додаватися нефітотоксичні масла та масляні концентрати.

Приклади застосування

Гербіцидну активність заміщених гетероароліом фенілаланінамідів формули I можна показати на наступних експериментах у теплиці:

Як ємності для вирощування використовували пластикові горщики для квітів із глинистим піском з прибл. 3,0% гумусу як субстрату. Насіння рослин, які тестують, висівають розділеними за сортами.

При досходовій обробці суспендовані у воді та емульговані діючі речовини наносять безпосередньо після висіву за допомогою сопел, що здатні тонко їх розподіляти. Горщики злегка зрошують, щоб сприяти проростанню та росту, і потім покривають прозорими пластиковими ковпаками доти, поки рослини не приростуть. Це покриття потрібно для забезпечення рівномірного проростання рослин, які досліджуються, якщо цьому не перешкоджають діючі речовини.

Для післясходової обробки рослини, які досліджуються, вирощують залежно від форми росту спочатку до висоти від 3 до 15см і тільки потім обробляються суспендованими у воді або емульгованими діючими речовинами. Досліджувані рослини або висіваються безпосередньо та вирощуються у тих же ємностях або вирощуються як паростки спочатку окремо та за декілька днів перед обробкою пересаджуються в ємності для експериментів. Норми витрати для

післясходової обробки становили 0,5, 0,25, 0,125, відповідно, 0,0625кг/га активної речовини.

Рослини витримують залежно від виду при температурі від 10 до 25°C, відповідно, від 20 до 35°C. Період експерименту поширюється на більш ніж 2-4 тижні. Протягом цього часу за рослинами доглядають та оцінюють їх реакцію на окремі прийоми обробки.

Оцінку здійснювали за шкалою від 0 до 100. При цьому 100 означає відсутність сходів рослин, відповідно, повне руйнування принаймні надземних частин та 0 означає відсутність ураження або нормальне протікання росту.

Застосовані в експериментах у теплицях рослини складаються з наступних видів:

Латинське назва	Загальна назва
<i>Abutilon theophrasti</i>	канатник Теофраста
<i>Amaranthus retroflexus</i>	щириця звичайна
<i>Avena fatua</i>	вівсюг
<i>Chenopodium album</i>	лобода багатонасіннева
<i>Galium aparine</i>	підмаренник чіпкий
<i>Polygonum convolvulus</i>	гірчак березкоподібний
<i>Setaria viridis</i>	мишій зелений

При нормах витрати 1,00кг/га сполуки 3.2, 3.10, 3.11 та 3.28 (таблиця 3) при післясходовій обробці проявляють гарну дію проти небажаних рослин, таких, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева та мишій зелений.

Також сполуки 3.66, 3.67 та 3.128 (таблиця 3) при нормах витрати 1,0кг/га при післясходовій обробці виявили дуже гарну активність проти таких небажаних рослин, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева та мишій зелений.

Далі сполуки 3.96, 3.61 та 3.131 (таблиця 3) при післясходовій обробці при нормах витрати 0,5кг/га виявили дуже гарну дію на таких небажаних рослинах, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева, підмаренник чіпкий та гірчак березкоподібний.

Сполука 3.65 (таблиця 3) при післясходовій обробці при нормах витрати 0,5кг/га проявляє дуже гарну дію на бур'яни: щириця звичайна, лобода багатонасіннева та гірчак кучерявий.

При нормах витрати 0,5кг/га сполуки 3.62 (таблиця 3) та 4.24 (таблиця 4) при післясходовій обробці виявили дуже гарну дію проти таких небажаних рослин, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева, підмаренник чіпкий та гірчак березкоподібний.

Далі сполука 3.152 (таблиця 3) при післясходовій обробці при нормах витрати 1,0кг/га виявила дуже гарну активність проти таких шкідливих рослин, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева, підмаренник чіпкий та мишій зелений.

Сполуки 3.123 та 3.137 (таблиця 3) при післясходовій обробці при нормах витрати 1,0кг/га виявили дуже гарну дію на таких бур'янах, як

щириця звичайна, лобода багатонасіннева та гірчак березкоподібний.

Також і сполука 3.154 (таблиця 3) при нормах витрати 1,0кг/га при післясходовій обробці виявила дуже гарну активність проти таких небажаних рослин, як щириця звичайна, лобода багатонасіннева, підмаренник чіпкий, гірчак березкоподібний та мишій зелений.

Сполука 5.20 (таблиця 5) при післясходовій обробці при нормах витрати 0,5кг/га виявила дуже гарну активність на бур'ян канатник Теофраста.

При нормах витрати 0,5кг/га сполука 5.36 (таблиця 5) при післясходовій обробці виявила дуже гарну дію проти канатника Теофраста.

Сполука 5.37 (таблиця 5) при післясходовій обробці при нормах витрати 0,5кг/га виявила дуже гарну активність при боротьбі з такими небажаними рослинами, як канатник Теофраста та вівсюг.