



УКРАЇНА

(19) UA (11) 81767 (13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 43/90

A01N 47/38 (2006.01)

A01P 7/00

C07D 471/10 (2006.01)

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

(54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З КОМАХАМИ, КЛІЩАМИ АБО НЕМАТОДАМИ ТА КОМПОЗИЦІЯ НА ОСНОВІ СПІРОІНДОЛІНОВИХ ПОХІДНИХ, ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ

1

2

(21) a200500282

(22) 04.06.2003

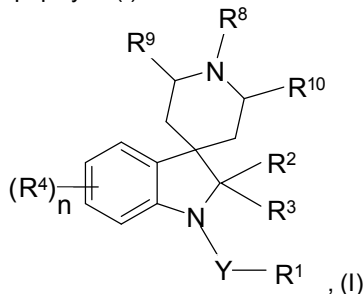
(24) 11.02.2008

(86) PCT/GB03/02424, 04.06.2003

(31) 0213715.6

(32) 14.06.2002

(33) GB

(72) ХЬЮЗ ДЕВІД ДЖОН, УЕРДІНГТОН ПОЛ
ЕНТОНІ, РАССЕЛЛ ЧАРЛЬЗ АДАМ, КЛАРК ЕРІК
ДЕНІЕЛ, ПІС ДЖЕЙМС ЕДВАРД, АШТОН МАРК
РИЧАРД, КОУЛТЕР ТОМАС СТЕФАН, РОБЕРТС
РИЧАРД СПЕРРІНГ, GB/ES, МОЛЛЕІР ЛУІ-П'ЄР,
СЕДЕРБАУМ ФРЕДРІК, SE/CH, КАССЕР ЖЕРОМ,
FR/CH, МАЙЄНФІШ ПЕТЕР(73) СІНГЕНТА ЛІМІТЕД, СІНГЕНТА
ПАРТІСІПЕЙШНС АГ(56) WO 9501358, A1, 12.01.1995
WO 0145707, A1, 28.06.2001
DUTTA ALOKE K. et al. JOURNAL OF MEDICINAL
CHEMISTRY, 1998, vol. 41(5), p.699-705
DATABASE CHEMCATS [Online] Chemical Abstract
Service, Columbus, Ohio, US, XP002254514(57) 1. Спосіб боротьби з комахами, кліщами або
нематодами, який полягає в обробці шкідника,
місця його заселення або рослини, підданої
ураженню шкідником, інсектицидно, акарицидно
або нематодично ефективною кількістю сполуки
формули (I):у якій Y означає простий зв'язок, C=O або S(O)_q,
де q означає 0, 1 або 2,R¹ означає водень, C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-
C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₅-
C₆циклоалкеніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-
C₆алкінілокси(C₁-C₆)алкіл, фенокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-
C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл,
C₂-C₆алкенілкарбоніл (C₁-C₆)алкіл, C₂-
C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-
C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-
C₆алкенілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-
C₆алкінілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл,
феноксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілтіо(C₁-
C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфініл(C₁-C₆)алкіл, C₁-
C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-
C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл,
ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл,
феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група
необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-
C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом,
C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
фенілом, гетероариллом, аміногрупою або
діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де
гетероарильна група може бути заміщена
галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-
C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою
або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C₁-
C₄)алкіл (де гетероциклільна група може бути
заміщена галогеном, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом,
C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-
C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-
C₆алкілкарбоніл, амінокарбоніл, C₁-
C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-
C₆)алкіламінокарбоніл, феніл (необов'язково
заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-
C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-
C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
фенілом, гетероариллом, аміногрупою або
діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково
заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою,
C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-
C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою),
C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу,
феноксигрупу (де фенільна група необов'язково
може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-
C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-
C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,

(13) C2

(11) 81767

(19) UA

фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилоксігрупу (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), ціаногрупу, С₂-С₆алкеніл, С₂-С₆галоалкеніл, С₂-С₆ціаноалкеніл, амінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, ді(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, феніл(С₂-С₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), С₂-С₆алкініл, амінокарбоніл(С₂-С₆)алкініл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкініл, ді(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкініл, С₃-С₇циклоалкіл, С₃-С₇галоциклоалкіл, С₃-С₇ціаноциклоалкіл, С₁-С₃алкіл(С₃-С₇)циклоалкіл, С₁-С₃алкіл(С₃-С₇)галоциклоалкіл, С₅-С₆циклоалкеніл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₁-С₈алкілтіогрупу або R¹³R¹⁴N, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, COR⁴⁰, С₁-С₆алкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном або С₁-С₃алкілом) або R¹³ і R¹⁴ разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють групу -N=C(R⁴¹)-NR⁴²R⁴³, де R⁴¹, R⁴² і R⁴³ незалежно один від одного являють собою H або С₁-С₄алкіл, R² і R³ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₆алкіл, С₁-С₆галоалкіл, С₁-С₆алкоксигрупу або ціаногрупу, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, С₁-С₈алкіл, С₁-С₆галоалкіл, С₁-С₆ціаноалкіл, С₃-С₇циклоалкіл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкоксі(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкоксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкілкарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл, ді(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл, феніл(С₁-С₆)алкіл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(С₁-С₆)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₂-С₆алкеніл, С₂-С₆галоалкеніл, С₂-С₆алкініл, С₁-С₆алкоксикарбоніл, С₁-С₆алкілкарбоніл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл, ди(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл, С₃-С₇циклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або

діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₈алкоксигрупу, C₁-C₈галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилкоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою),
n означає 0, 1, 2, 3 або 4,
R⁸ означає C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном, фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або C-(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають H, галоген або C₁-C₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, C₁-C₄алкіл або C₁-C₄галоалкіл і R⁵⁵ означає феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою),
R⁹ і R¹⁰ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₂алкіл або галоген, R⁴⁰ означає H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,

фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група обов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою) або NR⁴⁴R⁴⁵, де R⁴⁴ і R⁴⁵ незалежно один від одного означають C₁-C₆алкіл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

2. Спосіб за п. 1, де Y означає простий зв'язок, C=O або SO₂.

3. Спосіб за п. 1 або 2, де R¹ означає водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл, C₁-C₆алкоксі(C₁-C₆)алкіл, гетероарил(C₁-C₆)алкіл (де гетероарильна група обов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою, C₁-C₆галоалкоксигрупою, C₁-C₆алкілсульфонілом, C₁-C₆алкілсульфінілом, C₁-C₆алкілтіогрупою, C₁-C₆алкоксикарбонілом, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупою або фенілкарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке, у свою чергу, необов'язково заміщене галогеном), феніл(C₁-C₆)алкіл (де фенільна група обов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою, C₁-C₆галоалкоксигрупою, C₁-C₆алкілсульфонілом, C₁-C₆алкілсульфінілом, C₁-C₆алкілтіогрупою, C₁-C₆алкоксикарбонілом, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупою або фенілкарбонілом або два суміжні положення в фенільній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке, у свою чергу, необов'язково заміщене галогеном), феніл(який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою, C₁-C₆галоалкоксигрупою, C₁-C₆алкілсульфонілом, C₁-C₆алкілсульфінілом, C₁-C₆алкілтіогрупою, C₁-C₆алкоксикарбонілом, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупою або фенілкарбонілом або два суміжні положення в фенільній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке, у свою чергу, необов'язково заміщене галогеном), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою,

C₁-C₆галоалкоксигрупою, C₁-C₆алкілсульфонілом, C₁-C₆алкілсульфінілом, C₁-C₆алкілтіогрупою, C₁-C₆алкоксикарбонілом, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупою або фенілкарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке, у свою чергу, необов'язково заміщене галогеном), C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група обов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероциклілоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), ціаногрупу, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₅-C₇циклоалкеніл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆алкілтіогрупу, C₁-C₆галоалкілтіогрупу або NR¹³R¹⁴, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, C₂-C₆алкіл, C₂-C₆галоалкіл, феніл (який необов'язково може бути заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою або C₁-C₄алкоксикарбонілом), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₄алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, фенілоксикарбоніламіногрупу (де фенільна група обов'язково заміщена галогеном, C₁-C₆алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу або феніламіногрупу (де фенільна група обов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

4. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де R² і R³ незалежно один від одного означають водень або C₁-C₄алкіл.

5. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₅-C₆алкоксі(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкініл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксі(C₁-C₆)алкіл, феноксі(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкенілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-

С₆алкоксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₃-
 С₆алкенілоксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₃-
 С₆алкінілоксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл,
 феноксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкілтіо(С₁-
 С₆)алкіл, С₁-С₆алкілсульфініл(С₁-С₆)алкіл, С₁-
 С₆алкілсульфоніл(С₁-С₆)алкіл, амінокарбоніл(С₁-
 С₆)алкіл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл,
 ді(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл, феніл(С₁-
 С₄)алкіл (де фенільна група необов'язково
 заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), гетероарил(С₁-С₄)алкіл (де
 гетероарильна група необов'язково заміщена
 галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-
 С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою
 або С₁-С₆галоалкоксигрупою), гетероцикліл(С₁-
 С₆)алкіл (де гетероциклільна група необов'язково
 заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-
 С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою
 або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₂-С₆алкеніл,
 амінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, С₁-
 С₆алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, ді(С₁-
 С₆)алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкеніл, феніл(С₂-
 С₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково
 заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), С₂-С₆алкініл,
 триметилсиліл(С₂-С₆)алкініл, амінокарбоніл(С₂-
 С₆)алкініл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкініл,
 ді(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₂-С₆)алкініл, С₁-
 С₆алкоксикарбоніл, С₃-С₇циклоалкіл, С₃-
 С₇галоциклоалкіл, С₃-С₇ціаноциклоалкіл, С₁-
 С₃алкіл(С₃-С₇)циклоалкіл, С₁-С₃алкіл(С₃-
 С₇)галоциклоалкіл, феніл (необов'язково
 заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково
 заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою,
 С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-
 С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою),
 гетероцикліл (який необов'язково заміщений
 галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-
 С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою
 або С₁-С₆галоалкоксигрупою), або 2 суміжні групи
 R⁴ разом з атомами вуглецю, до яких вони
 приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне
 карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке
 необов'язково може бути заміщене С₁-
 С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою,
 феноксигрупою (необов'язково заміщену галогеном,
 нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-
 С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-
 С₆галоалкоксигрупою), гетероарилоксигрупою
 (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою,
 ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-
 С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою),
 С₁-С₈алкілтіогрупою, або R¹⁹R²⁰N, де R¹⁹ і R²⁰
 незалежно один від одного означають водень, С₁-
 С₆алкіл, С₃-С₇циклоалкіл, С₃-С₆алкеніл, С₃-
 С₆алкініл, С₂-С₆галоалкіл або С₁-

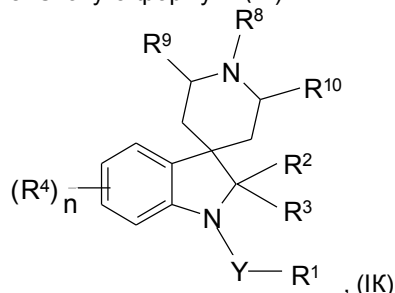
С₆алкоксикарбоніл або R¹⁹ і R²⁰ разом з N-атомом,
 до якого вони приєднані, утворюють п'яти-, шести-
 або семичленне гетероциклічне кільце, яке може
 містити один або два додаткові гетероатоми,
 вибрані з O, N або S, і необов'язково може бути
 заміщене однією або двома С₁-С₆алкільними
 групами, та

n означає 0, 1, 2, 3 або 4.

6. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де R⁸
 означає С₁-С₁₀алкіл, С₁-С₁₀галоалкіл, феніл(С₁-
 С₆)алкіл (де фенільна група необов'язково
 заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), гетероарил(С₁-С₆)алкіл (де
 гетероарильна група необов'язково заміщена
 галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-
 С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою
 CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом,
 аміногрупою або діалкіламіногрупою),
 фенілкарбоніл(С₁-С₆)алкіл (де фенільна група
 необов'язково може бути заміщена галогеном, С₁-
 С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом,
 С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою, а алкільна група
 необов'язково може бути заміщена фенілом), С₂-
 С₈алкеніл, С₂-С₈галоалкеніл, феніл(С₂-С₆)алкеніл
 (де фенільна група необов'язково заміщена
 галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-
 С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою
 CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом,
 аміногрупою, діалкіламіногрупою або С₁-
 С₆алкоксикарбонілом або два суміжні замісники
 можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6-
 або 7-членного карбоциклічного або
 гетероциклічного кільця), С₂-С₆алкініл, феніл(С₂-
 С₆)алкініл (де фенільна група необов'язково
 заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), С₃-С₇циклоалкіл, С₁-
 С₆алкоксикарбоніл, С₁-С₆алкілкарбоніл, С₁-
 С₆галоалкілкарбоніл, феніл(С₂-С₆)алкенілкарбоніл
 (де фенільна група необов'язково може бути
 заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-
 С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-
 С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂,
 фенілом, гетероарилом, аміногрупою або
 діалкіламіногрупою), або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-
 R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один
 від одного означають H, галоген або С₁-С₂алкіл,
 R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H,
 галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵
 означає феніл (необов'язково заміщений
 галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-
 С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою
 CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом,
 аміногрупою або діалкіламіногрупою) або
 гетероарил (необов'язково заміщений галогеном,
 С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-
 С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою
 CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом,
 аміногрупою або діалкіламіногрупою).

7. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, де R^9 і R^{10} обидва означають водень.

8. Сполука формули (IK)



у якій Y означає простий зв'язок, C=O або S(O)_q, де q означає 0, 1 або 2,

R^1 означає C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілокси(C₁-C₆)алкіл, фенокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксиалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкенілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феноксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілтіо(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфініл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C₁-C₄)алкіл (де гетероциклільна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆галоалкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галоалкеніл, C₂-C₆ціаноалкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою) або C₁-C₆алкілтіогрупу, R^2 і R^3 незалежно один від одного означають водень або C₁-C₄алкіл, R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у

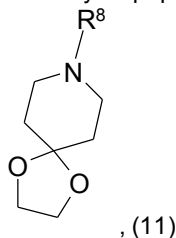
свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), або C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою),

n означає 0, 1, 2, 3 або 4,

R^8 означає C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), або C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), або C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який, у свою чергу, необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), і

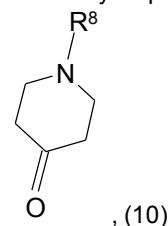
R^9 і R^{10} обидва означають водень, і її солі або N-оксиди, за умови, що R^8 не означає метил, а YR^1 не означає SO₂CH₃, метил, етил, феніл або заміщений фтором феніл.

9. Сполука формули (11)



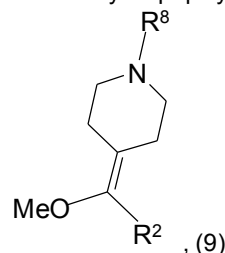
у якій R^8 означає феніл(C₂-C₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), за умови, що R^8 не означає цинаміл або 4-фторцинаміл.

10. Сполука формули (10)



у якій R^8 означає феніл(C₂-C₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), за умови, що R^8 не означає цинаміл або 4-фторцинаміл.

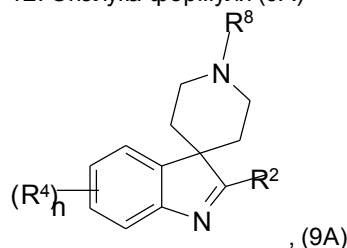
11. Сполука формули (9)



у якій R^2 має вказані для формули (I) у п. 1 значення, а

R^8 означає феніл(C_2 - C_4)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

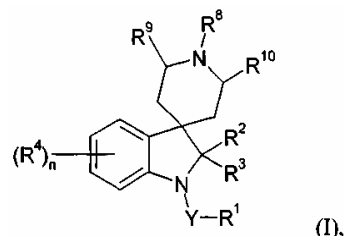
12. Сполука формули (9A)



Даний винахід стосується спіроіндолінових похідних, способу їх одержання, інсектицидних, акарицидних, моллюскоцидних і нематоцидних композицій і способів їх застосування для боротьби з такими шкідниками, як комахи, кліщі, моллюски і нематоди.

Спіроіндолінові похідні, які мають фармацевтичні властивості, описані, наприклад, у [US 5536716, US 4307235, WO 98/25605, WO 94/29309, WO 98/28297 і WO 99/64002]. Методи синтезу деяких сполук з фармацевтичними властивостями описані в [Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 92, 1995, с.7001, у Tetrahedron, 53, 1997, с.10983, і в Tetrahedron Letters, 38, 1997, с.1497]. Відповідно до винаходу несподівано було встановлено, що деякі спіроіндоліни мають і інсектицидні властивості.

Відповідно до цього у винаході пропонується спосіб боротьби з такими шкідниками, як комахи, кліщі, нематоди або моллюски, який полягає в обробці шкідника, місця його заселення або рослини, підданої ураженню шкідником, інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або моллюскоцидно ефективною кількістю сполуки формули (I):



у якій Y означає простий зв'язок, $C=O$, $C=S$ або $S(O)_q$, де q означає 0, 1 або 2, R^1 означає водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил,

у якій R^2 і $(R^4)_n$ мають вказані для формули (I) у п. 1 значення, а

R^8 означає феніл(C_2 - C_4)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , фенілом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

13. Інсектицидна, акарицидна або нематоцидна композиція, яка містить інсектицидно, акарицидно або нематоцидно ефективну кількість сполуки формули (I), як вона визначена у п. 1, та прийнятні носій та розріджувач.

необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений циклоалкеніл, форміл, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкілтіогрупу, NO або $NR^{13}R^{14}$, де R^{13} і R^{14} незалежно один від одного означають водень, COR^{10} , необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил або необов'язково заміщений гетероцикліл або R^{13} і R^{14} разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють групу $-N=C(R^{41})-NR^{42}R^{43}$, R^2 і R^3 незалежно один від одного означають водень, галоген, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил або $C(O)NR^{15}R^{16}$, де R^{15} і R^{16} незалежно один від одного означають водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил або необов'язково заміщений гетероцикліл, або R^2 і R^3 спільно означають $=O$, або R^2 і R^3 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1 - C_8 алкіл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкеніл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену

алкілтіогрупу або $R^{19}R^{20}N$, де R^{19} і R^{20} незалежно один від одного означають водень, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_2 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл або C_1 - C_6 алкоксикарбоніл або R^{19} і R^{20} разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють п'яти-, шести- або семичленне гетероциклічне кільце, яке може містити один або два додаткові гетероатоми, вибраних з O, N або S, і необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 суміжні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке необов'язково може бути заміщене галогеном, p означає 0, 1, 2, 3 або 4, R^8 означає необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл або необов'язково заміщений алкенілкарбоніл, R^9 і R^{10} незалежно один від одного означають водень, галоген, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений арил або R^9 і R^{10} спільно утворюють групу $-CH_2-$, $-C\equiv N$ - або $-CH_2CH_2-$, R^{40} означає H, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу або $NR^{44}R^{45}$, R^{41} , R^{42} і R^{43} незалежно один від одного означають H або (нижч.)алкіл, R^{44} і R^{45} незалежно один від одного означають необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил, або її солей або N-оксидів.

Сполуки формули (I) можуть існувати у вигляді різних геометричних або оптичних ізомерів або у таутомерних формах. В обсяг даного винаходу включені всі можливі ізомери, таутомери і їх суміші в будь-яких співвідношеннях між індивідуальними компонентами таких сумішей, а також ізотопні форми, наприклад дейтеровані сполуки.

Кожен алкільний залишок або індивідуально, або як структурний елемент більш великих груп (таких як алкоксигрупа, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл) має прямий або розгалужений ланцюг і являє собою, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, н-гексил, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, ізобутил, -трет-бутил або неопентил.

У випадку необов'язково заміщеного алкільного залишку (коли він згадується індивідуально або є структурним елементом більш великих груп, таких як алкоксигрупа, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл) він може бути заміщений одним або декількома замісниками, вибраними з групи, яка включає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, $NCS-$, C_3 - C_7 циклоалкіл (який у свою чергу необов'язково

заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), C_5 - C_7 циклоалкеніл (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гідроксигрупу, C_1 - C_{10} алкоксигрупу, C_1 - C_{10} алкокси(C_1 - C_{10})алкоксигрупу, три(C_1 - C_4)алкілсиліл (C_1 - C_6)алкоксигрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл(C_1 - C_{10})алкоксигрупу, C_1 - C_{10} галоалкоксигрупу, арил(C_1 - C_4)алкоксигрупу (де арильна група є необов'язково заміщеною), C_3 - C_7 циклоалкілоксигрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), C_2 - C_{10} алкенілоксигрупу, C_2 - C_{10} алкінілоксигрупу, SH, C_1 - C_{10} алкілтіогрупу, C_1 - C_{10} галоалкілтіогрупу, арил(C_1 - C_4)алкілтіогрупу (де арильна група є необов'язково заміщеною), C_3 - C_7 циклоалкілтіогрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), три(C_1 - C_4)алкілсиліл(C_1 - C_6)алкілтіогрупу, арилтіогрупу (де арильна група є необов'язково заміщеною), C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галоалкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галоалкілсульфініл, арилсульфоніл (де арильна група може бути необов'язково заміщеною), три(C_1 - C_4)алкілсиліл, арилди(C_1 - C_4)алкілсиліл, (C_1 - C_4)алкілдіарилсиліл, триарилсиліл, C_1 - C_{10} алкілкарбоніл, HO_2C , C_1 - C_{10} алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл, ди(C_1 - C_6 алкіл)амінокарбоніл, N-(C_1 - C_3 алкіл)-N-(C_1 - C_3 алкокси)амінокарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбонілоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу (де арильна група є необов'язково заміщеною), ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбонілоксигрупу, оксими, такі як =NOалкіл, =NOгалоалкіл і =NOарил (які у свою чергу є необов'язково заміщеними), арил (який у свою чергу є необов'язково заміщеним), гетероарил (який у свою чергу є необов'язково заміщеним), гетероцикліл (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), арилоксигрупу (де арильна група є необов'язково заміщеною), гетероарилоксигрупу, (де гетероарильна група є необов'язково заміщеною), гетероциклілоксигрупу (де гетероциклільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), аміногрупу, C_1 - C_6 алкіламіногрупу, ди(C_1 - C_6)алкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, N-(C_1 - C_6)алкілкарбоніл-N-(C_1 - C_6)алкіламіногрупу, C_2 - C_6 алкенілкарбоніл, C_2 - C_6 алкінілкарбоніл, C_3 - C_6 алкенілоксикарбоніл, C_3 - C_6 алкінілоксикарбоніл, арилоксикарбоніл (де арильна група є необов'язково заміщеною) і арилкарбоніл (де арильна група є необов'язково заміщеною).

Алкенільні й алкінільні залишки можуть мати прямий або розгалужений ланцюг, а алкенільні залишки, крім того, можуть, коли це можливо, мати або (E)-, або (Z)-конфігурацію. Як приклад цих залишків можна назвати вініл, аліл і пропаргіль.

До переліку необов'язкових замісників алкенілу або алкінілу при наявності таких замісників належать ті ж необов'язкові замісники, які вказані вище для алкільного залишку.

Ацил у контексті даного винаходу являє собою необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілкарбоніл (наприклад ацетил), необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкенілкарбоніл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкінілкарбоніл, необов'язково заміщений

арилкарбоніл (наприклад бензоїл) або необов'язково заміщений гетероарилкарбоніл.

Галоген являє собою фтор, хлор, бром або йод.

Галоалкільні групи являють собою алкільні групи, які заміщені одним або декількома ідентичними або різними атомами галогену, наприклад CF_3 , CF_2Cl , CF_3CH_2 або CHF_2CH_2 .

Терміни "арил" і "ароматична кільцева система" у контексті даного винаходу стосуються кільцевих систем, які можуть бути моно-, бі- або трициклічними. Прикладами таких кілець служать феніл, нафталеніл, антраценіл, інденіл або фенантреніл. Переважною арильною групою є феніл. Крім цього терміни "гетероарил", "гетероароматичне кільце" або "гетероароматична кільцева система" стосуються ароматичної кільцевої системи, яка містить принаймні один гетероатом і яка складається або з одного кільця, або з двох або більше сконденсованих кілець. Одинокі кільця переважно містять до трьох, а біциклічні системи містять до чотирьох гетероатомів, переважно вибраних з азоту, кисню і сірки. Як приклад таких груп можна назвати фурил, тієніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, ізотіазоліл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,2,3-тіадіазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,2,5-тіадіазоліл, піридил, піримідиніл, піридазиніл, піразиніл, 1,2,3-триазиніл, 1,2,4-триазиніл, 1,3,5-триазиніл, бензофурил, бензізофурил, бензотієніл, бензізотієніл, індоліл, ізоіндоліл, індазоліл, бензотіазоліл, бензізотіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензімідазоліл, хінолініл, ізохінолініл, циннолініл, фталазиніл, хіназолініл, хіноксалініл, нафтиридиніл, бензотриазиніл, пуриніл, птеридиніл і індолізиніл. До переважних прикладів гетероароматичних залишків належать піридил, піримідил, триазиніл, тієніл, фурил, оксазоліл, ізоксазоліл і тіазоліл.

Терміни "гетероцикл" і "гетероцикліл" стосуються неароматичного кільця, яке містить до 10 атомів, включаючи один або декілька гетероатомів (переважно один або два гетероатоми), вибраних з O, S і N. Як приклад таких кілець можна назвати 1,3-діоксолан, тетрагідрофуран і морфолін.

До переліку необов'язкових замісників гетероциклілу при наявності таких замісників належать C_1 - C_6 алкіл і C_1 - C_6 галоалкіл, а також ті необов'язкові замісники, які перераховані вище для алкільного залишку.

Циклоалкіл являє собою циклопропіл, циклопентил або циклогексил.

Циклоалкеніл являє собою цикlopентеніл і циклогексеніл.

До переліку необов'язкових замісників циклоалкілу або циклоалкенілу при наявності таких замісників належать C_1 - C_3 алкіл, а також ті необов'язкові замісники, які перераховані вище для алкільного залишку.

До карбоциклічних кілець належать арильні, циклоалкільні і циклоалкенільні групи.

Необов'язкові замісники арилу або гетероарилу при наявності таких замісників незалежно один від одного вибрані з групи, яка включає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, NCS- , C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_2 галоалкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), C_5 - C_7 циклоалкеніл (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гідроксигрупу, C_1 - C_{10} алкоксигрупу, C_1 - C_{10} алкокси(C_1 - C_{10})алкоксигрупу, три(C_1 - C_4)алкілсиліл(C_1 - C_6)алкоксигрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл(C_1 - C_{10})алкоксигрупу, C_1 - C_{10} галоалкоксигрупу, арил(C_1 - C_4)алкоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена галогеном або C_1 - C_6 алкілом), C_3 - C_7 циклоалкілоксигрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), C_2 - C_{10} алкєнілоксигрупу, C_2 - C_{10} алкінілоксигрупу, SH , C_1 - C_{10} алкілтіогрупу, C_1 - C_{10} галоалкілтіогрупу, арил(C_1 - C_4)алкілтіогрупу, C_3 - C_7 циклоалкілтіогрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), три(C_1 - C_4)алкілсиліл(C_1 - C_6)алкілтіогрупу, арилтіогрупу, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галоалкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галоалкілсульфініл, арилсульфоніл, три(C_1 - C_4)алкілсиліл, арилди(C_1 - C_4)алкілсиліл, (C_1 - C_4)алкілдіарилсиліл, триарилсиліл, C_1 - C_{10} алкілкарбоніл, HO_2C , C_1 - C_{10} алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл, ди(C_1 - C_6 алкіл)амінокарбоніл, $\text{N-}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкіл})\text{-N-}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкокси})\text{амінокарбоніл}$, C_1 - C_6 алкілкарбонілоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу, ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбонілоксигрупу, арил (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гетероарил (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гетероцикліл (який у свою чергу необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом або галогеном), арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), гетероциклілоксигрупу (де гетероциклільна група необов'язково заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), аміногрупу, C_1 - C_6 алкіламіногрупу, ди(C_1 - C_6)алкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, $\text{N-}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{алкілкарбоніл-N-}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{алкіламіногрупу}))$ й арилкарбоніл (де арильна група у свою чергу необов'язково заміщена галогеном або C_1 - C_6 алкілом), або два суміжні положення в арильній або гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном або C_1 - C_6 алкілом. До переліку інших замісників арилу або гетероарилу належать арилкарбоніламіногрупа (де арильна група заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном), (C_1 - C_6)алкілоксикарбоніламіногрупа, (C_1 - C_6)алкілоксикарбоніл-N-(C_1 - C_6)алкіламіногрупа, арилоксикарбоніламіногрупа (де арильна група заміщена C_1 - C_6 алкілом або галогеном),

арилоксикарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арилсульфоніламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арилсульфоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арил-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), ариламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероариламіногрупа (де гетероарильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероцикліламіногрупа (де гетероциклільна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), амінокарбоніламіногрупа, C₁-C₆алкіламінокарбоніламіногрупа, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніламіногрупа, ариламінокарбоніламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арил-N-(C₁-C₆)алкіламінокарбоніламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), C₁-C₆алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа, ариламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), C₁-C₆алкілом або галогеном) і арил-N-(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупа (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном).

У випадку заміщених фенільних залишків, гетероциклільних і гетероарильних груп вони переважно заміщені одним або декількома замісниками, незалежно один від одного вибраними з групи, яка включає галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, C₁-C₆алкілтіогрупу, C₁-C₆галоалкілтіогрупу, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галоалкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆галоалкілсульфоніл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галоалкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл, нітрогрупу, ціаногрупу, CO₂H, C₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбоніл, R³¹R³²N і R³³R³⁴NC(O), де R³¹, R³², R³³ і R³⁴ незалежно один від одного означають водень або C₁-C₆алкіл. Іншими переважними замісниками є аміногрупа, діалкіламіногрупа, арил і гетероарил.

Галоалкенільні групи являють собою алкенільні групи, які заміщені одним або декількома ідентичними або різними атомами галогену.

Очевидно, що до діалкіламінозамісників належать такі, у яких діалкільні групи разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють п'яти-, шести-або семичленне гетероциклічне кільце, яке може містити один або два додаткові гетероатоми, вибраних з O, N або S, і яке необов'язково заміщене однією або двома вибраними незалежно один від одного (C₁-C₆)алкільними групами. Гетероциклічні кільця, які утворені за рахунок з'єднання двох груп біля N-атома, переважно являють собою піролідін, піперидин, тіоморфолін і морфолін, кожний з яких може бути заміщений однією або двома вибраними незалежно один від одного (C₁-C₆)алкільними групами.

Переважні необов'язкові замісники алкільного залишку, який при цьому може бути заміщений одним або декількома замісниками, вибрані з групи, яка включає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, NO₂C, C₁-C₁₀алкоксигрупу (яка у свою чергу необов'язково заміщена C₁-C₁₀алкоксигрупою), арил(C₁-C₄)алкоксигрупу, C₁-C₁₀алкілтіогрупу, C₁-C₁₀алкілкарбоніл, C₁-C₁₀алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл, (C₁-C₆)алкілкарбонілоксигрупу, необов'язково заміщений феніл, гетероарил, арилоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу, гетероарилоксигрупу, гетероцикліл, гетероциклілоксигрупу, C₃-C₇циклоалкіл (який у свою чергу необов'язково заміщений (C₁-C₆)алкілом або галогеном), C₃-C₇циклоалкілоксигрупу, C₅-C₇циклоалкеніл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆алкілсульфініл, три(C₁-C₄)алкілсиліл, три(C₁-C₄)алкілсиліл(C₁-C₆)алкоксигрупу, арилди(C₁-C₄)алкілсиліл, (C₁-C₄)алкілдіарилсиліл і триарилсиліл.

Переважні необов'язкові замісники алкенілу або алкінілу, кожний з яких при цьому може бути заміщений одним або декількома замісниками, вибрані з групи, яка включає галоген, C₃-C₇циклоалкіл і арил, що у свою чергу необов'язково може бути заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою.

Переважним необов'язковим замісником гетероциклілу є C₁-C₆алкіл.

Переважними необов'язковими замісниками циклоалкілу є галоген, ціаногрупа і C₁-C₃алкіл.

Переважними необов'язковими замісниками циклоалкенілу є C₁-C₃алкіл, галоген і ціаногрупа.

Одну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (IA), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок, C=O, C=S або S(O)_q, де q означає 0, 1 або 2, R¹ означає водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений циклоалкеніл, форміл, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкілтіогрупу або NR¹³R¹⁴, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил або необов'язково заміщений гетероцикліл, R² і R³ незалежно один від одного означають водень, галоген, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил або C(O)NR¹⁵R¹⁶,

де R^{15} і R^{16} незалежно один від одного означають водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил або необов'язково заміщений гетероцикліл, або R^2 і R^3 спільно означають $=O$, або R^2 і R^3 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1-C_8 алкіл, необов'язково заміщений C_2-C_6 алкеніл, необов'язково заміщений C_2-C_6 алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C_3-C_7 циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкілтіогрупу або $R^{19}R^{20}N$, де R^{19} і R^{20} незалежно один від одного означають водень, C_1-C_8 алкіл, C_3-C_7 циклоалкіл, C_3-C_6 алкеніл, C_3-C_6 алкініл, C_3-C_7 циклоалкіл(C_1-C_4)алкіл, C_2-C_6 галоалкіл, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл або R^{19} і R^{20} разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють п'яти-, шести- або семичленне гетероциклічне кільце, яке може містити один або два додаткові гетероатоми, вибраних з O, N або S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1-C_6 алкілними групами, або 2 суміжні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке необов'язково може бути заміщене галогеном, n означає 0, 1, 2, 3 або 4, R^8 означає необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл або необов'язково заміщений алкенілкарбоніл, R^9 і R^{10} незалежно один від одного означають водень, галоген, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений арил або R^9 і R^{10} спільно утворюють групу $-CH_2-$, $-CH=CH-$ або $-CH_2CH_2-$, або солі або N-оксиди таких сполук.

Іншу групу переважних сполук утворюють сполуки формули (IB), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок, $C=O$ або $S(O)_q$, де q означає 0, 1 або 2, R означає водень, C_1-C_8 алкіл, C_1-C_6 галоалкіл, C_1-C_6 ціаноалкіл, C_3-C_7 циклоалкіл(C_1-C_6)алкіл, C_5-C_6 циклоалкеніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкенілокси(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкінілокси(C_1-C_6)алкіл, арилокси(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 карбоксіалкіл, C_1-C_6 алкілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_2-C_6 алкенілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_2-C_6 алкінілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл,

C_6 алкенілоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкінілоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, арилоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілтіо(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілсульфініл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілсульфоніл(C_1-C_6)алкіл, амінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл, ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл, феніл(C_1-C_4)алкіл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1-C_4 алкілом, C_1-C_4 алкоксигрупою, C_1-C_4 галоалкілом, C_1-C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C_1-C_4)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C_1-C_4)алкіл (де гетероциклічна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C_1-C_4)алкіл (де гетероциклічна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), гетероарилоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1-C_4 алкілом, C_1-C_4 алкоксигрупою, C_1-C_4 галоалкілом, C_1-C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), C_1-C_6 алкоксигрупу, C_1-C_6 галоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1-C_4 алкілом, C_1-C_4 алкоксигрупою, C_1-C_4 галоалкілом, C_1-C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 галоалкеніл, C_2-C_6 ціаноалкеніл, амінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, феніл(C_2-C_6)алкеніл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1-C_4 алкілом, C_1-C_4 алкоксигрупою, C_1-C_4 галоалкілом, C_1-C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C_2-C_6 алкініл, амінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, C_3-C_7 циклоалкіл, C_3-C_7 галоциклоалкіл, C_3-C_7 ціаноциклоалкіл, C_1-C_3 алкіл(C_3-C_7)циклоалкіл, C_1-C_3 алкіл(C_3-C_7)галоциклоалкіл, C_5-C_6 циклоалкеніл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1-C_6 алкілом, C_1-C_6 галоалкілом, C_1-C_6 алкоксигрупою або C_1-C_6 галоалкоксигрупою), C_1-C_8 алкілтіогрупу або $R^{13}R^{14}N$, де R^{13} і R^{14} незалежно один від одного означають водень, COR^{40} , C_1-C_6 алкіл, арил (необов'язково заміщений

галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном або C₁-C₃алкілом) або R¹³ і R¹⁴ разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють групу -N=C(R⁴¹)-NR⁴²R⁴³, де R⁴¹, R⁴² і R⁴³ незалежно один від одного являють собою H або C₁-C₄алкіл, R² і R³ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або ціаногрупу, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феніл(C₁-C₆)алкіл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-C₆)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галоалкеніл, C₂-C₆алкініл, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл, C₃-C₇циклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₈алкоксигрупу, C₁-C₈галоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), n означає 0, 1, 2, 3 або 4, R⁸ означає C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном, фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

C₄галоалкілом, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають H, галоген або C₁-C₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, C₁-C₄алкіл або C₁-C₄галоалкіл і R⁵⁵ означає арил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), R⁹ і R¹⁰ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₂алкіл або галоген, R⁴⁰ означає H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою) або NR⁴⁴R⁴⁵, де R⁴⁴ і R⁴⁵ незалежно один від одного означають C₁-C₆алкіл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

Наступну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (1C), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок, C=O або S(O)_q, де q означає 0, 1 або 2, R¹ означає водень, C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₅-C₆циклоалкеніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілокси(C₁-C₆)алкіл, арилокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-

С6)алкіл, С2-С6алкенілкарбоніл(С1-С6)алкіл, С2-С6алкінілкарбоніл(С1-С6)алкіл, С1-С6алкоксикарбоніл(С1-С6)алкіл, С3-С6алкенілоксикарбоніл(С1-С6)алкіл, С3-С6алкінілоксикарбоніл(С1-С6)алкіл, арилоксикарбоніл(С1-С6)алкіл, С1-С6алкілтіо(С1-С6)алкіл, С1-С6алкілсульфініл(С1-С6)алкіл, С1-С6алкілсульфоніл(С1-С6)алкіл, амінокарбоніл(С1-С6)алкіл, С1-С6алкіламінокарбоніл(С1-С6)алкіл, ди(С1-С6)алкіламінокарбоніл(С1-С6)алкіл, феніл(С1-С4)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), гетероарил(С1-С4)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), гетероцикліл(С1-С4)алкіл (де гетероциклільна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С1-С6алкоксикарбоніл, С1-С6алкілкарбоніл, амінокарбоніл, С1-С6алкіламінокарбоніл, ди(С1-С6)алкіламінокарбоніл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С1-С6алкоксигрупу, С1-С6галоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С2-С6алкеніл, С2-С6галоалкеніл, С2-С6ціаноалкеніл, амінокарбоніл(С2-С6)алкеніл, С1-С6алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкеніл, ди(С1-С6)алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкеніл, феніл(С2-С4)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С2-С6алкініл, амінокарбоніл(С2-С6)алкініл, С1-С6алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкініл, ди(С1-С6)алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкініл, С3-С7циклоалкіл, С3-С7галоциклоалкіл, С3-С7ціаноциклоалкіл, С1-С3алкіл(С3-С7)циклоалкіл, С1-С3алкіл(С3-С7)галоциклоалкіл, С5-С6циклоалкеніл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С1-С8алкілтіогрупу або R¹³R¹⁴N, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, С1-С6алкіл, арил (необов'язково заміщений галогеном, С1-С3алкілом, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С3галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-

Сґалоалкоксигрупою) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном або С₁-С₃алкілом), R² і R³ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₆алкіл, С₁-С₆ґалоалкіл, С₁-С₆алкоксигрупу або ціаногрупу, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, СрС₃алкіл, С₁-С₆ґалоалкіл, С₁-С₆ціаноалкіл, С₃-С₇циклоалкіл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкоксикарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкілкарбоніл(С₁-С₆)алкіл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл, ди(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл(С₁-С₆)алкіл, феніл(С₁-С₆)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою), гетероарил(С₁-С₆)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою), С₂-С₆алкеніл, С₂-С₆ґалоалкеніл, С₂-С₆алкініл, С₁-С₆алкоксикарбоніл, С₁-С₆алкілкарбоніл, С₁-С₆алкіламінокарбоніл, ди(С₁-С₆)алкіламінокарбоніл, С₃-С₇циклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою), С₁-С₆алкоксигрупу, С₁-С₆ґалоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою) або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою) або гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆ґалоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆ґалоалкоксигрупою), n означає 0, 1, 2, 3 або 4, R⁸ означає С₁-С₁₀алкіл, необов'язково заміщений С₁-С₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом або С₁-С₄алкоксигрупою), С₂-С₆алкеніл, необов'язково заміщений С₁-С₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом або С₁-С₄алкоксигрупою) або С₂-С₆алкініл, необов'язково заміщений С₁-С₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом або С₁-С₄алкоксигрупою), R⁹ і R¹⁰ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₂алкіл або галоген, і солі або N-оксиди таких сполук.

Іншу групу переважних сполук утворюють сполуки формули (ID), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок або $C=O$, R^1 означає водень, C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 ціаноалкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_6)алкіл, C_5 - C_6 циклоалкеніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкенілокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкінілокси(C_1 - C_6)алкіл, арилокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 карбоксіалкіл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкенілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкінілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 -

COR⁴⁰, C₁-С₆алкіл, арил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₃алкілом, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₃галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном або C₁-С₃алкілом), R² і R³ незалежно один від одного означають водень або метил, переважно обидва означають водень, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-С₈алкіл, C₁-С₆галоалкіл, C₁-С₆ціаноалкіл, C₃-С₇циклоалкіл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкокси(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкоксикарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкілкарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкіламінокарбоніл(C₁-С₆)алкіл, ди(C₁-С₆)алкіламінокарбоніл(C₁-С₆)алкіл, феніл(C₁-С₆)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-С₆)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), C₂-С₆алкеніл, C₂-С₆галоалкеніл, C₂-С₆алкініл, C₁-С₆алкоксикарбоніл, C₁-С₆алкілкарбоніл, C₁-С₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-С₆)алкіламінокарбоніл, C₃-С₇циклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), C₁-С₆алкоксигрупу, C₁-С₆галоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), n означає 0, 1, 2, 3 або 4, R⁸ означає C₁-С₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-С₆алкоксигрупою, галогеном, фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом або C₁-С₄алкоксигрупою) або гетероарилом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]₂-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R і R незалежно один від одного означають H, галоген або C₁-C₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, C₁-С₄алкіл або C₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає арил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або

ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₁-С₈алкілтіогрупою або R¹³R¹⁴N, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₆алкіл, арил (необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆алкоксигрупою, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN або групою NO₂) або гетероарил (необов'язково заміщений галогеном або С₁-С₃алкілом), і солі або N-оксиди таких сполук.

Наступну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (I^{H'}), які являють собою сполуки формули (I), у якій R², R³, R⁴, R⁸, R⁹, R¹⁰ і n мають значення, вказані для сполук формули (I^{G'}), а R¹ означає C₁-С₈алкіл, C₁-С₆галоалкіл, C₁-С₆ціаноалкіл, C₃-С₇циклоалкіл(C₁-С₆)алкіл, C₅-С₆циклоалкеніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкокси(C₁-С₆)алкіл, C₃-С₆алкенілокси(C₁-С₆)алкіл, C₃-С₆алкінілокси(C₁-С₆)алкіл, арилокси(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆карбоксіалкіл, C₁-С₆алкілкарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₂-С₂алкенілкарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₂-С₆алкінілкарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкоксикарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₃-С₆алкенілоксикарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₃-С₆алкінілоксикарбоніл(C₁-С₆)алкіл, арилоксикарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкілтіо(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкілсульфініл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкілсульфоніл(C₁-С₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-С₆)алкіл, C₁-С₆алкіламінокарбоніл(C₁-С₆)алкіл, ди(C₁-С₆)алкіламінокарбоніл(C₁-С₆)алкіл, феніл(C₁-С₄)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-С₄)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C₁-С₄)алкіл (де гетероциклільна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), C₁-С₆алкоксикарбоніл, C₁-С₆алкілкарбоніл, амінокарбоніл, C₁-С₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-С₆)алкіламінокарбоніл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), C₁-С₆алкоксигрупу, C₁-С₆галоалкоксигрупу, арилоксигрупу (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), ціаногрупу, C₂-С₆алкеніл, C₂-С₆галоалкеніл, C₂-С₆ціаноалкеніл, амінокарбоніл(C₂-С₆)алкеніл, C₁-С₆алкіламінокарбоніл(C₂-С₆)алкеніл, ди(C₁-С₆)алкіламінокарбоніл(C₂-С₆)алкеніл, феніл(C₂-С₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-

С4алкоксигрупою, С1-С4галоалкілом, С1-С4галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), С2-С6алкініл, амінокарбоніл(С2-С6)алкініл, алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкініл, ди(С1-С6)алкіламінокарбоніл(С2-С6)алкініл, С3-С7циклоалкіл, С3-С7галоциклоалкіл, С3-С7ціаноциклоалкіл, С1-С3алкіл(С3-С7)циклоалкіл, С1-С3алкіл(С3-С7)галоциклоалкіл, С5-С6циклоалкеніл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С1-С6алкілом, С1-С6галоалкілом, С1-С6алкоксигрупою або С1-С6галоалкоксигрупою), С1-С6алкілтіогрупу або R¹³R¹⁴N, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, С1-С6алкіл, групу COR⁴⁰, С1-С6алкілкарбоніламіногрупу, фенілоксикарбоніламіногрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С1-С4алкілом, С1-С4алкоксигрупою, С1-С4галоалкілом, С1-С4галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), аміногрупу, С1-С6алкіламіногрупу або феніламіногрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С1-С4алкілом, С1-С4алкоксигрупою, С1-С4галоалкілом, С1-С4галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

Наступну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (IJ), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁹, R¹⁰ і n мають значення, вказані для сполук формули (IH), а R⁸ означає C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), або C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

Наступну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (I^{J1}), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁹, R¹⁰ і n мають значення, вказані для сполук формули (I^{H1}), а R⁸ означає C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений фенілом або гетероарилом (при цьому фенільна і гетероарильна групи необов'язково заміщені галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають H, галоген або C₁-C₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, C₁-C₄алкіл або C₁-C₄галоалкіл і R⁵⁵ означає арил, заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою

CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, або гетероарил, заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою.

Ще одну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (IK), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок, C=O або S(O)_q, де q означає 0, 1 або 2, R¹ означає C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілокси(C₁-C₆)алкіл, арилокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкенілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, арилоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілтїо(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфініл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група не обов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероциклі(C₁-C₄)алкіл (де гетероцикліальна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), феніл (не обов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероарил (не обов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галоалкеніл, C₂-C₆ціаноалкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл, форміл, гетероциклі (не обов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою) або C₁-C₆алкілтїогрупу, R² і R³ незалежно один від одного означають водень або C₁-C₄алкіл, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C₁-C₁₀алкіл, не обов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу не обов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), C₂-C₆алкеніл, не обов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу не обов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом або C₁-C₄алкоксигрупою), або C₂-C₆алкініл, не обов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу не обов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом

Ще одну групу переважних сполук утворюють сполуки формули (II), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок або $C \equiv O$, R^1 означає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 ціаноалкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкенілокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкінілокси(C_1 - C_6)алкіл, арилокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 карбоксіалкіл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкенілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкінілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкенілоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкінілоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, арилоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкілтіо(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфініл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл(C_1 - C_6)алкіл, амінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, феніл(C_1 - C_4)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C_1 - C_4)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галоалкоксигрупу, C_1 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галоалкеніл, C_6 - C_6 ціаноалкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, фенілоксикарбоніламіногрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом,

[illegible]

C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, R⁴⁰ означає H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилкоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), і R⁹ і R¹⁰ обидва означають водень або метил, і солі або N-оксиди таких сполук.

Групу більш переважних сполук утворюють сполуки формули (IM), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок або C=O, R¹ означає C₁-C₈алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкеніл окси-(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілокси(C₁-C₆)алкіл, арилокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкенілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, арилоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілтію(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфініл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де гетероарильна група може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), гетероцикліл(C₁-C₄)алкіл (де гетероциклільна група може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою,

C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галоалкеніл, C₂-C₆ціаноалкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл, форміл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-C₆алкілом, C₁-C₆галоалкілом, C₁-C₆алкоксигрупою або C₁-C₆галоалкоксигрупою), C₁-C₆алкілтіюгрупу, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, фенілоксикарбоніламіногрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу або феніламіногрупу (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), R² і R³ незалежно один від одного означають водень або метил, переважно обидва означають водень, R⁴ у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений C₁-C₆алкоксигрупою, галогеном або фенілом (який у свою чергу необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), n означає 0, 1, 2, 3 або 4, R⁸ означає феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³]₂-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, більш переважно z означає 1, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають H, галоген або C₁-C₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, C₁-C₄алкіл або C₁-C₄галоалкіл і R⁵⁵ означає феніл, заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом,

аміногрупою або діалкіламіногрупою, або гетероарил, заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, R⁴⁰ означає Н, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галоалкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галоалкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або гетероарилкоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, C₁-C₄алкілом, C₁-C₄алкоксигрупою, C₁-C₄галоалкілом, C₁-C₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), і солі або N-оксиди таких сполук.

У переважному варіанті Y означає простий зв'язок, C=O, C=S або S(O)_q, де q означає 0, 1 або 2.

У більш переважному варіанті Y означає простий зв'язок, C=O або SO₂.

У найбільш переважному варіанті Y означає простий зв'язок або OO , насамперед $C=O$.

R^1 переважно означає водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 ціаноалкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою, C_1 - C_6 галоалкоксигрупою, C_1 - C_6 алкілсульфонілом, C_1 - C_6 алкілсульфінілом, C_1 - C_6 алкілтіогрупою, C_1 - C_6 алкоксикарбонілом, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупою або арилкарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), арил(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою, C_1 - C_6 галоалкоксигрупою, C_1 - C_6 алкілсульфонілом, C_1 - C_6 алкілсульфінілом, C_1 - C_6 алкілтіогрупою, C_1 - C_6 алкоксикарбонілом, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупою або арилкарбонілом або два суміжні положення в арильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), C_1 - C_6 алкілкарбоніламіно(C_1 - C_6)алкіл, арил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 -

С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою, С₁-С₆галоалкоксигрупою, С₁-С₆алкілсульфонілом, С₁-С₆алкілсульфінілом, С₁-С₆алкілтіогрупою, С₁-С₆алкоксикарбонілом, С₁-С₆алкілкарбоніламіногрупою або арилкарбонілом або два суміжні положення в арильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою, С₁-С₆галоалкоксигрупою, С₁-С₆алкілсульфонілом, С₁-С₆алкілсульфінілом, С₁-С₆алкілтіогрупою, С₁-С₆алкоксикарбонілом, С₁-С₆алкілкарбоніламіногрупою або арилкарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), С₁-С₆алкоксигрупою, С₁-С₆галоалкоксигрупою, феноксигрупою (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероариллоксигрупою (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), гетероциклілоксигрупою (необов'язково заміщену галогеном, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), ціаногрупою, С₂-С₆алкеніл, С₂-С₆алкініл, С₃-С₆циклоалкіл, С₅-С₇циклоалкеніл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₁-С₆алкілтіогрупою, С₁-С₆галоалкілтіогрупою або NR¹³R¹⁴, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, С₂-С₆алкіл, С₂-С₆галоалкіл, феніл (який необов'язково може бути заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою або С₁-С₄алкоксикарбонілом), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою), С₁-С₄алкоксикарбоніл, С₁-С₆алкілкарбоніламіногрупою, фенілоксикарбоніламіногрупою (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), аміногрупою, С₁-С₆алкіламіногрупою або феніламіногрупою (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

галогеном, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), ціаногрупою, C₂-С₆алкеніл, C₃-С₆циклоалкіл, C₅-С₇циклоалкеніл, гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою або C₁-С₆галоалкоксигрупою), C₁-С₆алкіліогрупою, C₁-С₆галоалкіліогрупою або NR¹³R¹⁴, де R¹³ і R¹⁴ незалежно один від одного означають водень, COR⁴⁰, C₂-С₆алкіл, C₂-С₆галоалкіл, феніл (який необов'язково може бути заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою або C₁-С₆алкоксикарбонілом), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою, C₁-С₆галоалкоксигрупою або C₁-С₄алкоксикарбонілом), C₁-С₆алкілкарбоніламіногрупою, фенілоксикарбоніламіногрупою (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), аміногрупою, C₁-С₆алкіламіногрупою або феніламіногрупою (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

У ще більш переважному варіанті R¹ означає C₁-С₆алкіл, C₁-С₆галоалкіл, C₁-С₆алкокси(C₁-С₆)алкіл, гетероарил(C₁-C₃)алкіл (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C₁-С₆алкілом, C₁-С₆галоалкілом, C₁-С₆алкоксигрупою, C₁-С₆галоалкоксигрупою, C₁-С₆алкілсульфонілом або C₁-С₆алкоксикарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), феніл(C₁-C₃)алкіл (де фенільна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою, C₁-С₆алкілсульфонілом або C₁-С₆алкоксикарбонілом або два суміжні положення у фенільному кільці можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), феніл (який необов'язково може бути заміщений галогеном, C₁-С₄алкілом, C₁-С₄алкоксигрупою, C₁-С₄галоалкілом, C₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою, C₁-С₆алкілсульфонілом або C₁-С₆алкоксикарбонілом або два суміжні положення у фенільному кільці можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або

гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), гетероарил (який необов'язково може бути заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою, C_1 - C_6 галоалкоксигрупою, C_1 - C_6 алкілсульфонілом або C_1 - C_6 алкоксикарбонілом або два суміжні положення в гетероарильній системі можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, яке у свою чергу необов'язково заміщене галогеном), C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галоалкоксигрупу, C_1 - C_6 алкеніл, гетероциклі (необов'язково заміщений галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 галоалкілтіогрупу або $NR^{13}R^{14}$, де R^{13} і R^{14} незалежно один від одного означають водень, C_2 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 галоалкіл, C_2 - C_6 алкілкарбоніл або фенілкарбоніл (де феніл необов'язково заміщений галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою).

Найбільш переважно R^1 означає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, гетероарил(C_1 - C_3)алкіл (у якому гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом або C_1 - C_6 галоалкілом), де гетероарильна група являє собою піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце, гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом або C_1 - C_6 галоалкілом), який являє собою піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце, C_1 - C_6 алкоксигрупу або гетероциклі (необов'язково заміщений галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_3 алкілом, C_1 - C_3 галоалкілом або C_1 - C_3 алкоксигрупою).

Особливо переважно R^1 означає піридил (необов'язково заміщений галогеном, C_1 - C_3 алкілом або C_1 - C_3 галоалкілом) або C_1 - C_6 алкоксигрупу, насамперед заміщений галогеном піридил.

У переважному варіанті R^2 і R^3 незалежно один від одного означають водень або C_1 - C_4 алкіл.

Більш переважно R^2 і R^3 незалежно один від одного означають водень або метил.

У ще більш переважному варіанті R^2 означає водень, а R^3 означає водень або метил.

Найбільш переважно R^2 і R^3 обидва означають водень.

У переважному варіанті R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_8 галоалкіл, C_1 - C_6 ціаноалкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_6)алкіл, C_5 - C_6 циклоалкеніл(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкенілокси(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкінілокси(C_1 - C_6)алкіл, арилокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 карбоксіалкіл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкенілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкінілкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкенілоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_3 - C_6 алкінілоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, арилоксикарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкілтіо(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкілсульфініл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 -

C_6 алкілсульфоніл(C_1 - C_6)алкіл, амінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбоніл(C_1 - C_6)алкіл, феніл(C_1 - C_4)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C_1 - C_4)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), гетероциклі(C_1 - C_4)алкіл (де гетероциклічна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_2 - C_6 алкеніл, амінокарбоніл(C_2 - C_6)алкеніл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл(C_2 - C_6)алкеніл, ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбоніл(C_2 - C_6)алкеніл, феніл(C_2 - C_4)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C_2 - C_6 алкініл, триметилсиліл(C_2 - C_6)алкініл, амінокарбоніл(C_2 - C_6)алкініл, C_1 - C_6 алкіламінокарбоніл(C_2 - C_6)алкініл, ди(C_1 - C_6)алкіламінокарбоніл(C_2 - C_6)алкініл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_7 галоциклоалкіл, C_3 - C_7 ціаноциклоалкіл, C_1 - C_3 алкіл(C_3 - C_7)циклоалкіл, C_1 - C_3 алкіл(C_3 - C_7)галоциклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), гетероциклі (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), феноксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою) або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), гетероарилкоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_1 - C_8 алкілтіогрупу або $R^{19}R^{20}N$, де R^{19} і R^{20} незалежно один від одного означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галоалкіл або C_1 - C_6 алкоксикарбоніл або R^{19} і R^{20} разом з N-атомом, до якого вони приєднані, утворюють п'яти-, шести- або семичленне гетероциклічне кільце, яке може містити один або два додаткові гетероатоми, вибраних з O, N або S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 суміжні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке

необов'язково може бути заміщене галогеном, а n означає 0, 1, 2, 3 або 4.

Більш переважно R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_8 галоалкіл, C_1 - C_8 ціаноалкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкініл, триметилсиліл(C_2 - C_6)алкініл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_1 - C_3 алкіл(C_3 - C_7)циклоалкіл, феніл (необов'язково заміщений галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_6 алкілом, C_1 - C_6 галоалкілом, C_1 - C_6 алкоксигрупою або C_1 - C_6 галоалкоксигрупою), C_1 - C_8 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галоалкоксигрупу, феноксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилкоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, C_1 - C_3 алкілом, C_1 - C_3 галоалкілом, C_1 - C_3 алкоксигрупою або C_1 - C_3 галоалкоксигрупою) або ди(C_1 - C_8)алкіламіногрупу або 2 суміжні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке необов'язково може бути заміщене галогеном, а n означає 0, 1, 2, 3 або 4.

У ще більш переважному варіанті R^4 у кожному випадку незалежно означає галоген, ціаногрупу, C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_8 галоалкіл, C_1 - C_8 ціаноалкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_2 - C_6 алкініл, гетероцикліл (необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкілом), C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галоалкоксигрупу, феноксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_3 алкілом або C_1 - C_3 галоалкілом), гетероарилкоксигрупу (необов'язково заміщену галогеном, ціаногрупою, C_1 - C_3 алкілом або C_1 - C_3 галоалкілом) або ди(C_1 - C_8)алкіламіногрупу або 2 суміжні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке необов'язково може бути заміщене галогеном, а n означає 0, 1, 2, 3 або 4;

У ще більш переважному варіанті R^4 у кожному випадку незалежно означає фтор, хлор, бром, ціаногрупу, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галоалкіл, C_1 - C_4 ціаноалкіл або C_1 - C_3 алкокси(C_1 - C_3)алкіл, а n означає 0, 1 або 2.

Найбільш переважно R^4 у кожному випадку незалежно означає фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галоалкіл, а n означає 1 або 2.

У переважному варіанті R^8 означає C_1 - C_{10} алкіл, C_1 - C_{10} галоалкіл, арил(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z означає 1 або 2, R^{51} і R^{52} незалежно один

необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), арилкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, а алкільна група необов'язково може бути заміщена арилом), C_2 - C_8 алкеніл, C_2 - C_8 галоалкеніл, арил(C_2 - C_6)алкеніл (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або C_1 - C_6 алкоксикарбоніл або два суміжні замісники можуть бути замкнуті в цикл з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця), C_2 - C_6 алкініл, феніл(C_2 - C_6)алкініл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C_3 - C_7 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 галоалкілкарбоніл, арил(C_2 - C_6)алкенілкарбоніл (де арильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z означає 1 або 2, R^{51} і R^{52} незалежно один від одного означають H, галоген або C_1 - C_2 алкіл, R^{53} і R^{54} незалежно один від одного означають H, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галоалкіл і R^{55} означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

Більш переважно R^8 означає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галоалкіл, арил(C_1 - C_4)алкіл (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C_2 - C_6 алкеніл, арил(C_2 - C_6)алкеніл (де арильна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), C_2 - C_6 алкініл, феніл(C_2 - C_6)алкініл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, C_1 - C_4 алкілом, C_1 - C_4 алкоксигрупою, C_1 - C_4 галоалкілом, C_1 - C_4 галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO_2 , арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z означає 1 або 2, R^{51} і R^{52} незалежно один

від одного означають Н, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають Н, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

У ще більш переважному варіанті R⁸ означає феніл(С₁-С₄)алкіл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарил(С₁-С₆)алкіл (де гетероарильна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл(С₂-С₆)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), феніл(С₂-С₆)алкініл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають Н, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають Н, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

У ще більш переважному варіанті R⁸ означає фенілСН₂- (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилСН₂- (де гетероарильна група являє собою біциклічну групу, необов'язково заміщену галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою) або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають Н, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають Н, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

В особливо переважному варіанті R⁸ означає феніл(С₂-С₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₃алкілом, С₁-С₃галоалкілом, С₁-С₃алкоксигрупою, С₁-С₃алкоксикарбонілом або С₁-С₃галоалкоксигрупою) або феніл(С₂-С₄)алкініл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₃алкілом, С₁-С₃галоалкілом, С₁-С₃алкоксигрупою, С₁-С₃алкоксикарбонілом або С₁-С₃галоалкоксигрупою) або R⁸ означає -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵²

незалежно один від одного означають Н, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають Н, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає феніл, заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, або гетероарил, заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою.

У найбільш переважному варіанті R⁸ означає -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, переважно 1, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають Н, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають Н, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає феніл, заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою, або гетероарил, заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою.

У переважному варіанті R⁹ і R¹⁰ обидва означають водень.

R⁵¹ і R⁵² переважно означають водень.

R⁵³ і R⁵⁴ переважно означають водень або галоген, насамперед водень.

R⁵⁵ переважно означають феніл, заміщений одним-трьма замісниками, вибраними з галогену, С₁-С₄алкіли, С₁-С₄алкоксигрупи, С₁-С₄галоалкілу, С₁-С₄галоалкоксигрупи, групи CN, групи NO₂, арилу, гетероарилу, аміногрупи і діалкіламіногрупи.

Деякі сполуки формули (I) є новими і відповідно до цього становлять ще один об'єкт винаходу. Так, наприклад, до нових сполук належать описані вище сполуки формули (IK) і їх солі або N-оксиди, за умови, що R⁸ не означає метил, а YR¹ не означає SO₂CH₃, метил, етил, феніл або заміщений фтором феніл.

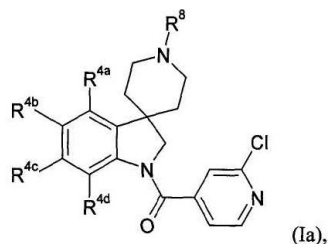
До інших нових сполук належать сполуки формули (IN), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає простий зв'язок або С=O, R¹ означає С₁-С₆алкіл, С₁-С₆галоалкіл, гетероарил(С₁-С₃)алкіл (де гетероарильна група необов'язково може бути заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою і являє собою піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце), гетероарил (необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою і представляє собою піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце), С₁-С₆алкоксигрупу або гетероцикліл (необов'язково заміщений галогеном, ціаногрупою, С₁-С₃алкілом, С₁-С₃галоалкілом або

С₁-С₃алкоксигрупою), R⁴ у кожному випадку незалежно означає фтор, хлор, бром, ціаногрупу, С₁-С₄алкіл, С₁-С₄галоалкіл, С₁-С₄ціаноалкіл або С₁-С₃алкокси(С₁-С₃)алкіл, n означає 0, 1 або 2, R⁸ означає феніл(С₂-С₄)алкеніл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою або С₁-С₃алкоксикарбонілом) або феніл(С₂-С₄)алкініл (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою, діалкіламіногрупою або С₁-С₃алкоксикарбонілом), а R², R³, R⁹ і R¹⁰ означають водень.

Ще одну групу нових сполук утворюють сполуки формули (IP), які являють собою сполуки формули (I), у якій Y означає C(O), R¹ означає піридил (необов'язково заміщений галогеном, С₁-С₃алкілом або С₁-С₃галоалкілом) або С₁-С₆алкоксигрупу, R², R³, R⁹ і R¹⁰ означають водень, R⁴ означає фтор, хлор, бром, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл, n означає 1 або 2 і R⁸ означає фенілCH₂- (де фенільна група необов'язково заміщена галогеном, С₁-С₄алкілом, С₁-С₄алкоксигрупою, С₁-С₄галоалкілом, С₁-С₄галоалкоксигрупою, групою CN, групою NO₂, арилом, гетероарилом, аміногрупою або діалкіламіногрупою), гетероарилCH₂- (де гетероарильна група являє собою біциклічну групу, необов'язково заміщену галогеном, нітрогрупою, ціаногрупою, С₁-С₆алкілом, С₁-С₆галоалкілом, С₁-С₆алкоксигрупою або С₁-С₆галоалкоксигрупою) або -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, де z означає 1 або 2, R⁵¹ і R⁵² незалежно один від одного означають H, галоген або С₁-С₂алкіл, R⁵³ і R⁵⁴ незалежно один від одного означають H, галоген, С₁-С₄алкіл або С₁-С₄галоалкіл і R⁵⁵ означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил, за умови, що а) коли (R⁴)_n означає 5-фтор, а R¹ означає 2,6-дихлорпірид-4-ил, то R⁸ не означає 4-метилбензил, 3-метилбензил, 4-трифторметоксибензил, 4-трифторметилбензил, 4-ціанобензил, 4-метилкарбонілбензил або цинаміл і, б) коли (R⁴)_n означає 5-фтор, а R¹ означає 2-хлорпірид-4-ил, то R⁸ не означає 3-хлорбензил, 3,5-дифторбензил, 4-трифторметоксибензил, 4-трифторметилбензил, 4-ціанобензил або 4-метилкарбонілбензил.

У наведених нижче таблицях I-XXXII представлені конкретні запропоновані у винаході сполуки.

У таблиці I представлена 301 сполука формули Ia



де значення замісників R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

Таблиця 1

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1	цинаміл	H	H	H	H
I-2	4-хлорцинаміл	H	H	H	H
I-3	4-фторцинаміл	H	H	H	H
I-4	4-нітроцинаміл	H	H	H	H
I-5	4-метоксицинаміл	H	H	H	H
I-6	4-метилцинаміл	H	H	H	H
I-7	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H
I-8	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H
I-9	2,4-дихлорцинаміл	H	H	H	H
I-10	2,4-дифторцинаміл	H	H	H	H
I-11	цинаміл	Cl	H	H	H
I-12	4-хлорцинаміл	Cl	H	H	H
I-13	4-фторцинаміл	Cl	H	H	H
I-14	4-нітроцинаміл	Cl	H	H	H
I-15	4-метоксицинаміл	Cl	H	H	H
I-16	4-метилцинаміл	Cl	H	H	H
I-17	4-трифторметилцинаміл	Cl	H	H	H
I-18	4-ціаноцинаміл	Cl	H	H	H
I-19	2,4-дихлорцинаміл	Cl	H	H	H
I-20	2,4-дифторцинаміл	Cl	H	H	H
I-21	цинаміл	H	Cl	H	H
I-22	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H
I-23	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H
I-24	4-нітроцинаміл	H	Cl	H	H
I-25	4-метоксицинаміл	H	Cl	H	H
I-26	4-метилцинаміл	H	Cl	H	H
I-27	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H
I-28	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H
I-29	2,4-дихлорцинаміл	H	Cl	H	H

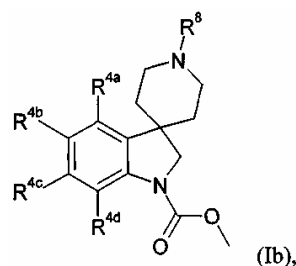
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-30	2,4-дифторцинамил	H	Cl	H	H
I-31	цинамил	H	H	Cl	H
I-32	4-хлорцинамил	H	H	Cl	H
I-33	4-фторцинамил	H	H	Cl	H
I-34	4-нітроцинамил	H	H	Cl	H
I-35	4-метоксицинамил	H	H	Cl	H
I-36	4-метилцинамил	H	H	Cl	H
I-37	4-трифторметилцинамил	H	H	Cl	H
I-38	4-ціаноцинамил	H	H	Cl	H
I-39	2,4-дихлорцинамил	H	H	Cl	H
I-40	2,4-дифторцинамил	H	H	Cl	H
I-41	цинамил	H	H	H	Cl
I-42	4-хлорцинамил	H	H	H	Cl
I-43	4-фторцинамил	H	H	H	Cl
I-44	4-нітроцинамил	H	H	H	Cl
I-45	4-метоксицинамил	H	H	H	Cl
I-46	4-метилцинамил	H	H	H	Cl
I-47	4-трифторметилцинамил	H	H	H	Cl
I-48	4-ціаноцинамил	H	H	H	Cl
I-49	2,4-дихлорцинамил	H	H	H	Cl
I-50	2,4-дифторцинамил	H	H	H	Cl
I-51	цинамил	F	H	H	H
I-52	4-хлорцинамил	F	H	H	H
I-53	4-фторцинамил	F	H	H	H
I-54	4-нітроцинамил	F	H	H	H
I-55	4-метоксицинамил	F	H	H	H
I-56	4-метилцинамил	F	H	H	H
I-57	4-трифторметилцинамил	F	H	H	H
I-58	4-ціаноцинамил	F	H	H	H
I-59	2,4-дихлорцинамил	F	H	H	H
I-60	2,4-дифторцинамил	F	H	H	H
I-61	цинамил	H	F	H	H
I-62	4-хлорцинамил	H	F	H	H
I-63	4-фторцинамил	H	F	H	H
I-64	4-нітроцинамил	H	F	H	H
I-65	4-метоксицинамил	H	F	H	H
I-66	4-метилцинамил	H	F	H	H
I-67	4-трифторметилцинамил	H	F	H	H
I-68	4-ціаноцинамил	H	F	H	H
I-69	2,4-дихлорцинамил	H	F	H	H
I-70	2,4-дифторцинамил	H	F	H	H
I-71	цинамил	H	H	F	H
I-72	4-хлорцинамил	H	H	F	H
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-73	4-фторцинамил	H	H	F	H
I-74	4-нітроцинамил	H	H	F	H
I-75	4-метоксицинамил	H	H	F	H
I-76	4-метилцинамил	H	H	F	H
I-77	4-трифторметилцинамил	H	H	F	H
I-78	4-ціаноцинамил	H	H	F	H
I-79	2,4-дихлорцинамил	H	H	F	H
I-80	2,4-дифторцинамил	H	H	F	H
I-81	цинамил	H	H	H	F
I-82	4-хлорцинамил	H	H	H	F
I-83	4-фторцинамил	H	H	H	F
I-84	4-нітроцинамил	H	H	H	F
I-85	4-метоксицинамил	H	H	H	F
I-86	4-метилцинамил	H	H	H	F
I-87	4-трифторметилцинамил	H	H	H	F
I-88	4-ціаноцинамил	H	H	H	F
I-89	2,4-дихлорцинамил	H	H	H	F
I-90	2,4-дифторцинамил	H	H	H	F
I-91	цинамил	Br	H	H	H
I-92	4-хлорцинамил	Br	H	H	H
I-93	4-фторцинамил	Br	H	H	H
I-94	4-нітроцинамил	Br	H	H	H
I-95	4-метоксицинамил	Br	H	H	H
I-96	4-метилцинамил	Br	H	H	H
I-97	4-трифторметилцинамил	Br	H	H	H
I-98	4-ціаноцинамил	Br	H	H	H
I-99	2,4-дихлорцинамил	Br	H	H	H
I-100	2,4-дифторцинамил	Br	H	H	H
I-101	цинамил	H	Br	H	H
I-102	4-хлорцинамил	H	Br	H	H
I-103	4-фторцинамил	H	Br	H	H
I-104	4-нітроцинамил	H	Br	H	H
I-105	4-метоксицинамил	H	Br	H	H
I-106	4-метилцинамил	H	Br	H	H
I-107	4-трифторметилцинамил	H	Br	H	H
I-108	4-ціаноцинамил	H	Br	H	H
I-109	2,4-дихлорцинамил	H	Br	H	H
I-110	2,4-дифторцинамил	H	Br	H	H
I-111	цинамил	H	H	Br	H
I-112	4-хлорцинамил	H	H	Br	H
I-113	4-фторцинамил	H	H	Br	H
I-114	4-нітроцинамил	H	H	Br	H
I-115	4-метоксицинамил	H	H	Br	H

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-116	4-метилцинамил	H	H	Br	H
I-117	4-трифторметилцинамил	H	H	Br	H
I-118	4-ціаноцинамил	H	H	Br	H
I-119	2,4-дихлорцинамил	H	H	Br	H
I-120	2,4-дифторцинамил	H	H	Br	H
I-121	цинамил	H	H	H	Br
I-122	4-хлорцинамил	H	H	H	Br
I-123	4-фторцинамил	H	H	H	Br
I-124	4-нітроцинамил	H	H	H	Br
I-125	4-метоксицинамил	H	H	H	Br
I-126	4-метилцинамил	H	H	H	Br
I-127	4-трифторметилцинамил	H	H	H	Br
I-128	4-ціаноцинамил	H	H	H	Br
I-129	2,4-дихлорцинамил	H	H	H	Br
I-130	2,4-дифторцинамил	H	H	H	Br
I-131	цинамил	H	Cl	H	Cl
I-132	4-хлорцинамил	H	Cl	H	Cl
I-133	4-фторцинамил	H	Cl	H	Cl
I-134	4-нітроцинамил	H	Cl	H	Cl
I-135	4-метоксицинамил	H	Cl	H	Cl
I-136	4-метилцинамил	H	Cl	H	Cl
I-137	4-трифторметилцинамил	H	Cl	H	Cl
I-138	4-ціаноцинамил	H	Cl	H	Cl
I-139	2,4-дихлорцинамил	H	Cl	H	Cl
I-140	2,4-дифторцинамил	H	Cl	H	Cl
I-141	цинамил	H	F	H	F
I-142	4-хлорцинамил	H	F	H	F
I-143	4-фторцинамил	H	F	H	F
I-144	4-нітроцинамил	H	F	H	F
I-145	4-метоксицинамил	H	F	H	F
I-146	4-метилцинамил	H	F	H	F
I-147	4-трифторметилцинамил	H	F	H	F
I-148	4-ціаноцинамил	H	F	H	F
I-149	2,4-дихлорцинамил	H	F	H	F
I-150	2,4-дифторцинамил	H	F	H	F
I-151	цинамил	Cl	F	H	H
I-152	4-хлорцинамил	Cl	F	H	H
I-153	4-фторцинамил	Cl	F	H	H
I-154	4-нітроцинамил	Cl	F	H	H
I-155	4-метоксицинамил	Cl	F	H	H
I-156	4-метилцинамил	Cl	F	H	H
I-157	4-трифторметилцинамил	Cl	F	H	H
I-158	4-ціаноцинамил	Cl	F	H	H
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-159	2,4-дихлорцинамил	Cl	F	H	H
I-160	2,4-дифторцинамил	Cl	F	H	H
I-161	цинамил	H	F	Cl	H
I-162	4-хлорцинамил	H	F	Cl	H
I-163	4-фторцинамил	H	F	Cl	H
I-164	4-нітроцинамил	H	F	Cl	H
I-165	4-метоксицинамил	H	F	Cl	H
I-166	4-метилцинамил	H	F	Cl	H
I-167	4-трифторметилцинамил	H	F	Cl	H
I-168	4-ціаноцинамил	H	F	Cl	H
I-169	2,4-дихлорцинамил	H	F	Cl	H
I-170	2,4-дифторцинамил	H	F	Cl	H
I-171	цинамил	H	Cl	Cl	H
I-172	4-хлорцинамил	H	Cl	Cl	H
I-173	4-фторцинамил	H	Cl	Cl	H
I-174	4-нітроцинамил	H	Cl	Cl	H
I-175	4-метоксицинамил	H	Cl	Cl	H
I-176	4-метилцинамил	H	Cl	Cl	H
I-177	4-трифторметилцинамил	H	Cl	Cl	H
I-178	4-ціаноцинамил	H	Cl	Cl	H
I-179	2,4-дихлорцинамил	H	Cl	Cl	H
I-180	2,4-дифторцинамил	H	Cl	Cl	H
I-181	цинамил	H	I	H	H
I-182	4-хлорцинамил	H	I	H	H
I-183	4-фторцинамил	H	I	H	H
I-184	4-нітроцинамил	H	I	H	H
I-185	4-метоксицинамил	H	I	H	H
I-186	4-метилцинамил	H	I	H	H
I-187	4-трифторметилцинамил	H	I	H	H
I-188	4-ціаноцинамил	H	I	H	H
I-189	2,4-дихлорцинамил	H	I	H	H
I-190	2,4-дифторцинамил	H	I	H	H
I-191	цинамил	H	OMe	H	H
I-192	4-хлорцинамил	H	OMe	H	H
I-193	4-фторцинамил	H	OMe	H	H
I-194	4-нітроцинамил	H	OMe	H	H
I-195	4-метоксицинамил	H	OMe	H	H
I-196	4-метилцинамил	H	OMe	H	H
I-197	4-трифторметилцинамил	H	OMe	H	H
I-198	4-ціаноцинамил	H	OMe	H	H
I-199	2,4-дихлорцинамил	H	OMe	H	H
I-200	2,4-дифторцинамил	H	OMe	H	H
I-201	цинамил	H	Me	H	H

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-202	4-хлорцинаміл	H	Me	H	H
I-203	4-фторцинаміл	H	Me	H	H
I-204	4-нітроцинаміл	H	Me	H	H
I-205	4-метоксицинаміл	H	Me	H	H
I-206	4-метилцинаміл	H	Me	H	H
I-207	4-трифторметилцинаміл	H	Me	H	H
I-208	4-ціаногинаміл	H	Me	H	H
I-209	2,4-дихлорцинаміл	H	Me	H	H
I-210	2,4-дифторцинаміл	H	Me	H	H
I-211	цинаміл	H	CN	H	H
I-212	4-хлорцинаміл	H	CN	H	H
I-213	4-фторцинаміл	H	CN	H	H
I-214	4-нітроцинаміл	H	CN	H	H
I-215	4-метоксицинаміл	H	CN	H	H
I-216	4-метилцинаміл	H	CN	H	H
I-217	4-трифторметилцинаміл	H	CN	H	H
I-218	4-ціаногинаміл	H	CN	H	H
I-219	2,4-дихлорцинаміл	H	CN	H	H
I-220	2,4-дифторцинаміл	H	CN	H	H
I-221	цинаміл	H	CCH	H	H
I-222	4-хлорцинаміл	H	CCH	H	H
I-223	4-фторцинаміл	H	CCH	H	H
I-224	4-нітроцинаміл	H	CCH	H	H
I-225	4-метоксицинаміл	H	CCH	H	H
I-226	4-метилцинаміл	H	CCH	H	H
I-227	4-трифторметилцинаміл	H	CCH	H	H
I-228	4-ціаногинаміл	H	CCH	H	H
I-229	2,4-дихлорцинаміл	H	CCH	H	H
I-230	2,4-дифторцинаміл	H	CCH	H	H
I-231	цинаміл	H	COOMe	H	H
I-232	4-хлорцинаміл	H	COOMe	H	H
I-233	4-фторцинаміл	H	COOMe	H	H
I-234	4-нітроцинаміл	H	COOMe	H	H
I-235	4-метоксицинаміл	H	COOMe	H	H
I-236	4-метилцинаміл	H	COOMe	H	H
I-237	4-трифторметилцинаміл	H	COOMe	H	H
I-238	4-ціаногинаміл	H	COOMe	H	H
I-239	2,4-дихлорцинаміл	H	COOMe	H	H
I-240	2,4-дифторцинаміл	H	COOMe	H	H
I-241	цинаміл	H	Me	Cl	H
I-242	4-хлорцинаміл	H	Me	Cl	H
I-243	4-фторцинаміл	H	Me	Cl	H
I-244	4-нітроцинаміл	H	Me	Cl	H
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-245	4-метоксицинаміл	H	Me	Cl	H
I-246	4-метилцинаміл	H	Me	Cl	H
I-247	4-трифторметилцинаміл	H	Me	Cl	H
I-248	4-ціаногинаміл	H	Me	Cl	H
I-249	2,4-дихлорцинаміл	H	Me	Cl	H
I-250	2,4-дифторцинаміл	H	Me	Cl	H
I-251	цинаміл	Cl	Me	H	H
I-252	4-хлорцинаміл	Cl	Me	H	H
I-253	4-фторцинаміл	Cl	Me	H	H
I-254	4-нітроцинаміл	Cl	Me	H	H
I-255	4-метоксицинаміл	Cl	Me	H	H
I-256	4-метилцинаміл	Cl	Me	H	H
I-257	4-трифторметилцинаміл	Cl	Me	H	H
I-258	4-ціаногинаміл	Cl	Me	H	H
I-259	2,4-дихлорцинаміл	Cl	Me	H	H
I-260	2,4-дифторцинаміл	Cl	Me	H	H
I-261	цинаміл	H	Cl	H	Me
I-262	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	Me
I-263	4-фторцинаміл	H	Cl	H	Me
I-264	4-нітроцинаміл	H	Cl	H	Me
I-265	4-метоксицинаміл	H	Cl	H	Me
I-266	4-метилцинаміл	H	Cl	H	Me
I-267	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	Me
I-268	4-ціаногинаміл	H	Cl	H	Me
I-269	2,4-дихлорцинаміл	H	Cl	H	Me
I-270	2,4-дифторцинаміл	H	Cl	H	Me
I-271	цинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-272	4-хлорцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-273	4-фторцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-274	4-нітроцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-275	4-метоксицинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-276	4-метилцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-277	4-трифторметилцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-278	4-ціаногинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-279	2,4-дихлорцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-280	2,4-дифторцинаміл	H	H	4-Cl-PhO	H
I-281	цинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-282	4-хлорцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-283	4-фторцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-284	4-нітроцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-285	4-метоксицинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-286	4-метилцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-287	4-трифторметилцинаміл	H	4-F-Ph	H	H

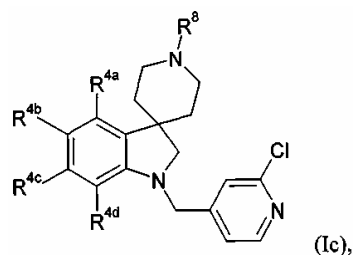
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-288	4-ціаногинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-289	2,4-дихлорцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-290	2,4-дифторцинаміл	H	4-F-Ph	H	H
I-291	цинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-292	4-хлорцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-293	4-фторцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-294	4-нітроцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-295	4-метоксицинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-296	4-метилцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-297	4-трифторметилцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-298	4-ціаногинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-299	2,4-дихлорцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-300	2,4-дифторцинаміл	H	CF ₃ O	H	H
I-301	C(O)CH=CH-4-хлорфеніл	H	4-CF ₃ -Ph	H	H

У таблиці II представлена 301 сполука формули Ib



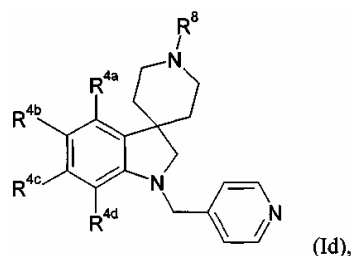
де значення замісників R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці III представлена 301 сполука формули Ic



де значення замісників R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

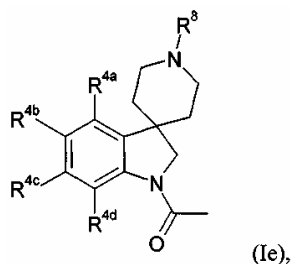
У таблиці IV представлена 301 сполука формули Id



де значення замісників R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці V представлена 301 сполука формули Ie

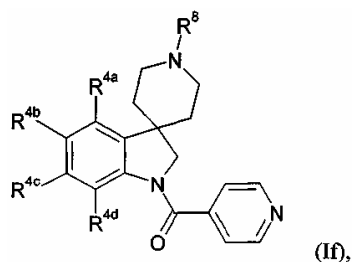
53



(Ie),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

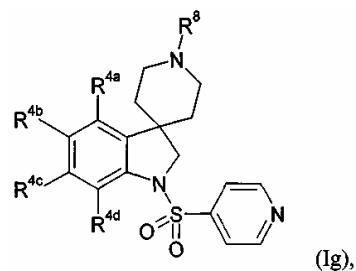
У таблиці VI представлена 301 сполука формули If



(If),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

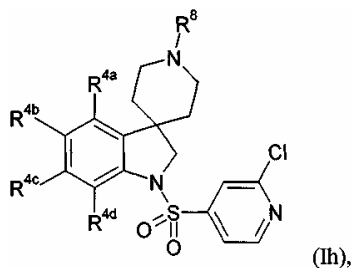
У таблиці VII представлена 301 сполука формули Ig



(Ig),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці VIII представлена 301 сполука формули Ih



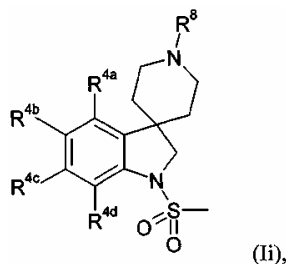
(Ih),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці IX представлена 301 сполука формули Ii

81767

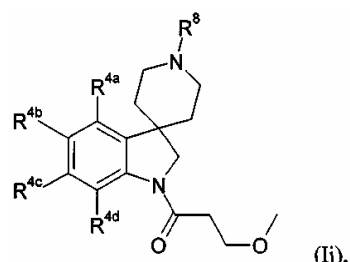
54



(Ii),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

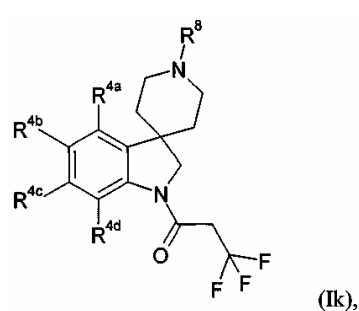
У таблиці X представлена 301 сполука формули Ij



(Ij),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

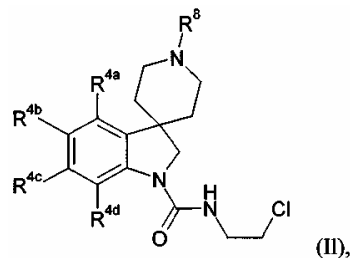
У таблиці XI представлена 301 сполука формули Ik



(Ik),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XII представлена 301 сполука формули Il

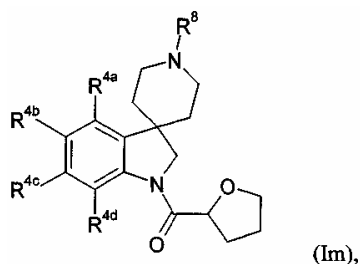


(Il),

де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

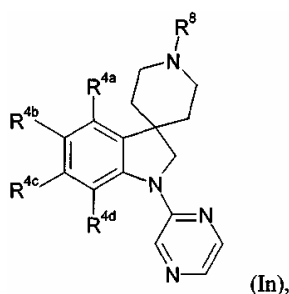
У таблиці XIII представлена 301 сполука формули Im

55



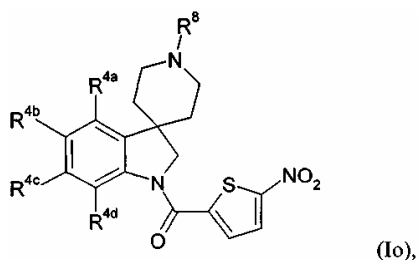
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XIV представлена 301 сполука формули In



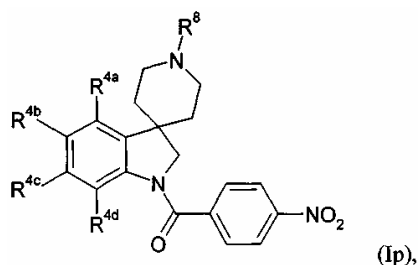
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XV представлена 301 сполука формули Io



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVI представлена 301 сполука формули Ip

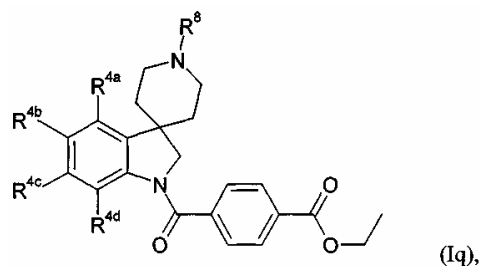


де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVII представлена 301 сполука формули Iq

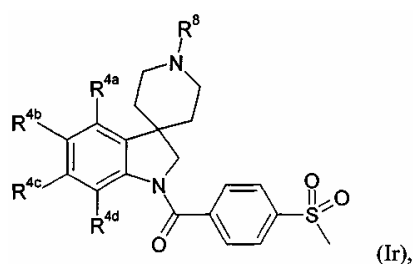
81767

56



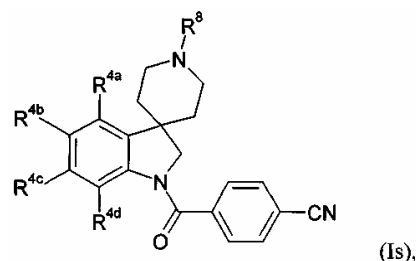
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVIII представлена 301 сполука формули Ir



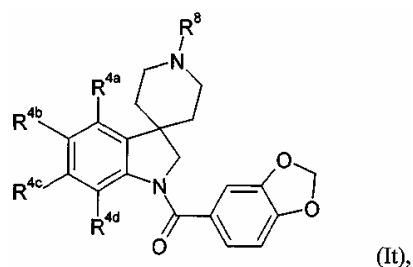
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XIX представлена 301 сполука формули Is



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

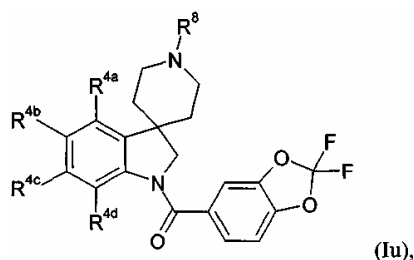
У таблиці XX представлена 301 сполука формули It



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

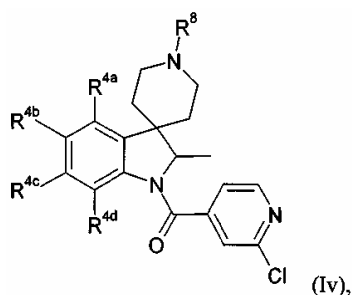
У таблиці XXI представлена 301 сполука формули Iu

57



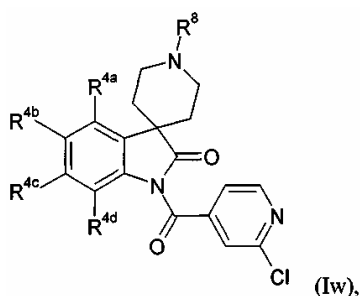
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXII представлена 301 сполука формули Iv



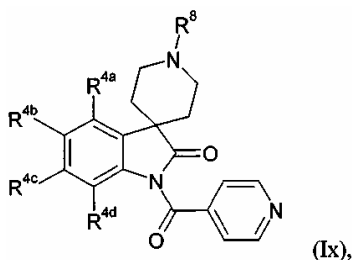
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXIII представлена 301 сполука формули Iw



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXIV представлена 301 сполука формули Ix

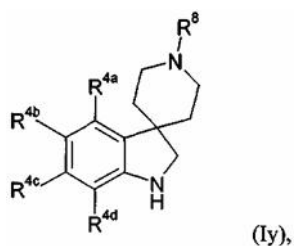


де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXV представлена 301 сполука формули Iy

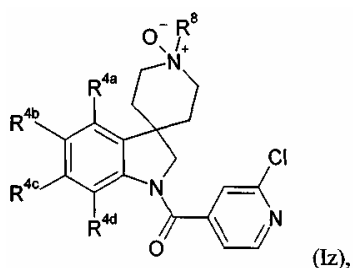
81767

58



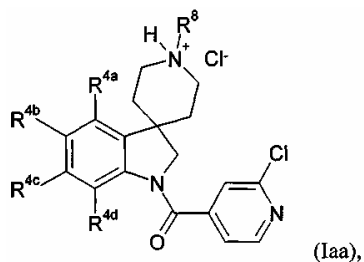
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVI представлена 301 сполука формули Iz



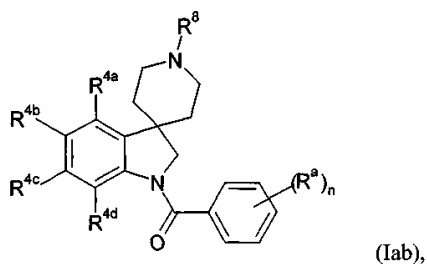
де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVII представлена 301 сполука формули Iaa



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} і R^{4d} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVIII представлено 270 сполук формули Iab



де значення замісників R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} , R^{4d} і $(R^a)_n$ наведені в таблиці 2.

Таблиця 2

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}	(R ^a) _n
XXVIII-1	цинаміл	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-2	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-3	4-фторцинаміл	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-4	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-5	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-6	цинаміл	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-7	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-8	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-9	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-10	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-11	цинаміл	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-12	4-хлорцинаміл	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-13	4-фторцинаміл	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-14	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-15	4-ціаноцинаміл	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-16	цинаміл	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-17	4-хлорцинаміл	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-18	4-фторцинаміл	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-19	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-20	4-ціаноцинаміл	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-21	цинаміл	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-22	4-хлорцинаміл	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-23	4-фторцинаміл	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-24	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-25	4-ціаноцинаміл	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-26	цинаміл	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-27	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-28	4-фторцинаміл	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-29	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	H	4-SMe
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}	(R ^a) _n
XXVIII-30	4-ціаноцинаміл	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-31	цинаміл	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-32	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-33	4-фторцинаміл	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-34	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-35	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-36	цинаміл	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-37	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-38	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-39	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-40	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-41	цинаміл	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-42	4-хлорцинаміл	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-43	4-фторцинаміл	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-44	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-45	4-ціаноцинаміл	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-46	цинаміл	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-47	4-хлорцинаміл	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-48	4-фторцинаміл	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-49	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-50	4-ціаноцинаміл	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-51	цинаміл	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-52	4-хлорцинаміл	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-53	4-фторцинаміл	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-54	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-55	4-ціаноцинаміл	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-56	цинаміл	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-57	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-58	4-фторцинаміл	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-59	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-60	4-ціаноцинаміл	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-61	цинаміл	H	H	H	H	4-F
XXVIII-62	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	4-F
XXVIII-63	4-фторцинаміл	H	H	H	H	4-F
XXVIII-64	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	4-F
XXVIII-65	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	4-F
XXVIII-66	цинаміл	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-67	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-68	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-69	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-70	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-71	цинаміл	H	F	H	H	4-F
XXVIII-72	4-хлорцинаміл	H	F	H	H	4-F
XXVIII-73	4-фторцинаміл	H	F	H	H	4-F

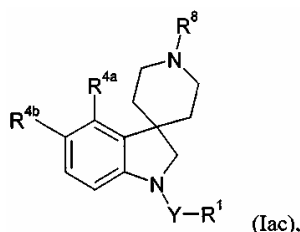
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}	(R ^a) _n
XXVIII-74	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	H	4-F
XXVIII-75	4-ціаноцинаміл	H	F	H	H	4-F
XXVIII-76	цинаміл	H	H	F	H	4-F
XXVIII-77	4-хлорцинаміл	H	H	F	H	4-F
XXVIII-78	4-фторцинаміл	H	H	F	H	4-F
XXVIII-79	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	H	4-F
XXVIII-80	4-ціаноцинаміл	H	H	F	H	4-F
XXVIII-81	цинаміл	H	F	H	F	4-F
XXVIII-82	4-хлорцинаміл	H	F	H	F	4-F
XXVIII-83	4-фторцинаміл	H	F	H	F	4-F
XXVIII-84	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	F	4-F
XXVIII-85	4-ціаноцинаміл	H	F	H	F	4-F
XXVIII-86	цинаміл	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-87	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-88	4-фторцинаміл	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-89	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-90	4-ціаноцинаміл	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-91	цинаміл	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-92	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-93	4-фторцинаміл	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-94	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-95	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-96	цинаміл	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-97	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-98	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-99	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-100	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-101	цинаміл	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-102	4-хлорцинаміл	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-103	4-фторцинаміл	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-104	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-105	4-ціаноцинаміл	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-106	цинаміл	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-107	4-хлорцинаміл	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-108	4-фторцинаміл	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-109	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-110	4-ціаноцинаміл	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-111	цинаміл	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-112	4-хлорцинаміл	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-113	4-фторцинаміл	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-114	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-115	4-ціаноцинаміл	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-116	цинаміл	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-117	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	H	3-CN
Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}	(R ^a) _n
XXVIII-118	4-фторцинаміл	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-119	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-120	4-ціаноцинаміл	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-121	цинаміл	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-122	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-123	4-фторцинаміл	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-124	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-125	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-126	цинаміл	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-127	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-128	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-129	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-130	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-131	цинаміл	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-132	4-хлорцинаміл	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-133	4-фторцинаміл	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-134	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-135	4-ціаноцинаміл	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-136	цинаміл	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-137	4-хлорцинаміл	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-138	4-фторцинаміл	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-139	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-140	4-ціаноцинаміл	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-141	цинаміл	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-142	4-хлорцинаміл	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-143	4-фторцинаміл	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-144	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-145	4-ціаноцинаміл	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-146	цинаміл	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-147	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-148	4-фторцинаміл	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-149	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-150	4-ціаноцинаміл	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-151	цинаміл	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-152	4-хлорцинаміл	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-153	4-фторцинаміл	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-154	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-155	4-ціаноцинаміл	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-156	цинаміл	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-157	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-158	4-фторцинаміл	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-159	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-160	4-ціаноцинаміл	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-161	цинаміл	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d} (R ⁴) _n
XXVIII-162	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-163	4-фторцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-164	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-165	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-166	цинаміл	H	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-167	4-хлорцинаміл	H	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-168	4-фторцинаміл	H	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-169	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-170	4-ціанодинаміл	H	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-171	цинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-172	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-173	4-фторцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-174	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-175	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-176	цинаміл	H	OMe	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-177	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-178	4-фторцинаміл	H	OMe	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-179	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-180	4-ціанодинаміл	H	OMe	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-181	цинаміл	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-182	4-хлорцинаміл	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-183	4-фторцинаміл	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-184	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-185	4-ціанодинаміл	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-186	цинаміл	H	Cl	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-187	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-188	4-фторцинаміл	H	Cl	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-189	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-190	4-ціанодинаміл	H	Cl	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-191	цинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-192	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-193	4-фторцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-194	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-195	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-196	цинаміл	H	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-197	4-хлорцинаміл	H	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-198	4-фторцинаміл	H	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-199	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-200	4-ціанодинаміл	H	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-201	цинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-202	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-203	4-фторцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-204	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-205	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d} (R ⁴) _n
XXVIII-206	цинаміл	H	OMe	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-207	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-208	4-фторцинаміл	H	OMe	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-209	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-210	4-ціанодинаміл	H	OMe	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-211	цинаміл	H	H	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-212	4-хлорцинаміл	H	H	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-213	4-фторцинаміл	H	H	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-214	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-215	4-ціанодинаміл	H	H	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-216	цинаміл	H	Cl	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-217	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-218	4-фторцинаміл	H	Cl	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-219	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-220	4-ціанодинаміл	H	Cl	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-221	цинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-222	4-хлорцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-223	4-фторцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-224	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-225	4-ціанодинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-226	цинаміл	H	H	F	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-227	4-хлорцинаміл	H	H	F	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-228	4-фторцинаміл	H	H	F	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-229	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-230	4-ціанодинаміл	H	H	F	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-231	цинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-232	4-хлорцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-233	4-фторцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-234	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-235	4-ціанодинаміл	H	F	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-236	цинаміл	H	OMe	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-237	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-238	4-фторцинаміл	H	OMe	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-239	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-240	4-ціанодинаміл	H	OMe	H	4- <i>n</i> -PrO
XXVIII-241	цинаміл	H	H	H	2-Me
XXVIII-242	4-хлорцинаміл	H	H	H	2-Me
XXVIII-243	4-фторцинаміл	H	H	H	2-Me
XXVIII-244	4-трифторметилцинаміл	H	H	H	2-Me
XXVIII-245	4-ціанодинаміл	H	H	H	2-Me
XXVIII-246	цинаміл	H	Cl	H	2-Me
XXVIII-247	4-хлорцинаміл	H	Cl	H	2-Me
XXVIII-248	4-фторцинаміл	H	Cl	H	2-Me
XXVIII-249	4-трифторметилцинаміл	H	Cl	H	2-Me

Сполука	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d} (R ⁴) _n
XXVIII-250	4-ціанодинаміл	H	Cl	H	2-Me
XXVIII-251	цинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-252	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-253	4-фторцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-254	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-255	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-256	цинаміл	H	H	F	2-Me
XXVIII-257	4-хлорцинаміл	H	H	F	2-Me
XXVIII-258	4-фторцинаміл	H	H	F	2-Me
XXVIII-259	4-трифторметилцинаміл	H	H	F	2-Me
XXVIII-260	4-ціанодинаміл	H	H	F	2-Me
XXVIII-261	цинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-262	4-хлорцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-263	4-фторцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-264	4-трифторметилцинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-265	4-ціанодинаміл	H	F	H	2-Me
XXVIII-266	цинаміл	H	OMe	H	2-Me
XXVIII-267	4-хлорцинаміл	H	OMe	H	2-Me
XXVIII-268	4-фторцинаміл	H	OMe	H	2-Me
XXVIII-269	4-трифторметилцинаміл	H	OMe	H	2-Me
XXVIII-270	4-ціанодинаміл	H	OMe	H	2-Me

У таблиці XXIX представлено 214 сполук формули Іас



де значення замісників R⁸, R^{4a}, R^{4b}, Y і R¹ наведені в таблиці 3.

Таблиця 3

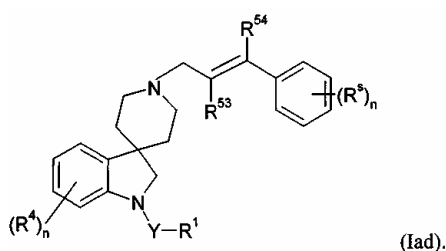
Сполука	R ¹	R ^{4a}	R ^{4b}	Y	R ¹
XXIX-1	2-(бензоксазоліл)метил	H	Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXIX-2	2-(бензоксазоліл)метил	H	F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXIX-3	2-(бензоксазоліл)метил	H	Cl	зв'язок	карбометокси
XXIX-4	2-(бензоксазоліл)метил	H	F	зв'язок	карбометокси
XXIX-5	2-(бензоксазоліл)метил	H	Cl	зв'язок	ацетил
XXIX-6	2-(бензоксазоліл)метил	H	F	зв'язок	ацетил
XXIX-7	2-метил-3-(3',4'-метилендіоксифеніл)проп-2-еніл	H	Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил

Сполука	R ¹	R ⁴	R ^{6b}	Y	R ¹
XXIX-8	2-метил-3-(3',4'-метилendioксифеніл)проп-2-еніл	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-9	2-метил-3-(3',4'-метилendioксифеніл)проп-2-еніл	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-10	2-метил-3-(3',4'-метилendioксифеніл)проп-2-еніл	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-11	2-метил-3-(3',4'-метилendioксифеніл)проп-2-еніл	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-12	2-метил-3-(3',4'-метилendioксифеніл)проп-2-еніл	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-13	3-фенілпроп-2-ініл	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-14	3-фенілпроп-2-ініл	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-15	3-фенілпроп-2-ініл	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-16	3-фенілпроп-2-ініл	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-17	3-фенілпроп-2-ініл	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-18	3-фенілпроп-2-ініл	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-19	трифторацетамiдо	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-20	трифторацетамiдо	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-21	трифторацетамiдо	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-22	трифторацетамiдо	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-23	трифторацетамiдо	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-24	трифторацетамiдо	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-25	4-хлоринамiт	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-26	4-хлоринамiт	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-27	4-хлоринамiт	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-28	4-хлоринамiт	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-29	4-хлоринамiт	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-30	4-хлоринамiт	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-31	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-32	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-33	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-34	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-35	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-36	2-оксо-2-(2'-хлор-4'-метилфеніл)етил	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-37	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-38	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-39	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-40	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-41	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-42	2-оксо-1,2-дифенілетил	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-43	3,3-дихлораліл	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-44	3,3-дихлораліл	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-45	3,3-дихлораліл	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-46	3,3-дихлораліл	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-47	3,3-дихлораліл	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-48	3,3-дихлораліл	H	F	3в'язок	ацетил
Сполука	R ¹	R ⁴	R ^{6b}	Y	R ¹
XXIX-49	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	F	3в'язок	H
XXIX-50	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	Cl	3в'язок	H
XXIX-51	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	Cl	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-52	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	F	C(O)	2-хлорпiрид-4-ил
XXIX-53	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	Cl	3в'язок	карбометокси
XXIX-54	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	F	3в'язок	карбометокси
XXIX-55	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	Cl	3в'язок	ацетил
XXIX-56	<i>трет</i> -бутилсульфоксикарбоніл	H	F	3в'язок	ацетил
XXIX-57	4-хлоринамiл	H	Cl	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-58	4-хлоринамiл	H	F	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-59	4-хлоринамiл	Br	H	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-60	4-фторинамiл	H	Cl	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-61	4-фторинамiл	H	F	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-62	4-фторинамiл	Br	H	3в'язок	5-триформетилпiрид-2-ил
XXIX-63	4-хлоринамiл	H	Cl	3в'язок	пiримiдин-2-іл
XXIX-64	4-хлоринамiл	H	F	3в'язок	пiримiдин-2-іл
XXIX-65	4-хлоринамiл	Br	H	3в'язок	пiримiдин-2-іл
XXIX-66	4-фторинамiл	H	Cl	3в'язок	пiримiдин-2-іл

Сполука	R ¹	R ² , R ^{4b}	Y	R ¹
XXIX-95	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	5-карбометоксипірид-2-ил
XXIX-96	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	5-карбометоксипірид-2-ил
XXIX-97	4-фторцинаміл	H F	C(O)	5-карбометоксипірид-2-ил
XXIX-98	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	5-карбометоксипірид-2-ил
XXIX-99	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-100	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-101	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-102	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-103	4-фторцинаміл	H F	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-104	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	4-хлорпірид-2-ил
XXIX-105	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-106	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-107	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-108	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-109	4-фторцинаміл	H F	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-110	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	2-метил-6-трифтометилпірид-3-ил
XXIX-111	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-112	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-113	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-114	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-115	4-фторцинаміл	H F	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-116	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	5-метилізоксазол-3-іл
XXIX-117	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-118	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-119	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-120	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-121	4-фторцинаміл	H F	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-122	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	(пірид-4-іл)метил
XXIX-123	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-124	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-125	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-126	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-127	4-фторцинаміл	H F	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-128	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	(тіофен-2-іл)метил
XXIX-129	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	циклопентил
XXIX-130	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	циклопентил
XXIX-131	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	циклопентил
XXIX-132	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	циклопентил
XXIX-133	4-фторцинаміл	H F	C(O)	циклопентил
XXIX-134	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	циклопентил
XXIX-135	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	ацетиламінометил
XXIX-136	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	ацетиламінометил
XXIX-137	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	ацетиламінометил
XXIX-138	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	ацетиламінометил
XXIX-139	4-фторцинаміл	H F	C(O)	ацетиламінометил
XXIX-140	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	ацетиламінометил
Сполука	R ¹	R ² , R ^{4b}	Y	R ¹
XXIX-141	4-хлорцинаміл	Br Cl	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-142	4-хлорцинаміл	H F	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-143	4-хлорцинаміл	Br H	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-144	4-фторцинаміл	H Cl	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-145	4-фторцинаміл	H F	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-146	4-фторцинаміл	Br H	SO ₂	4-ацетиламінофеніл
XXIX-147	4-хлорцинаміл	H Cl	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-148	4-хлорцинаміл	H F	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-149	4-хлорцинаміл	Br H	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-150	4-фторцинаміл	H Cl	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-151	4-фторцинаміл	H F	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-152	4-хлорцинаміл	Br H	SO ₂	3,5-диметилізоксазол-4-іл
XXIX-153	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-154	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-155	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-156	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-157	4-фторцинаміл	H F	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-158	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	(2-метоксифеніл)аміно
XXIX-159	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-160	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-161	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-162	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-163	4-фторцинаміл	H F	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-164	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	циклогексен-1-іл
XXIX-165	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-166	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-167	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-168	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-169	4-фторцинаміл	H F	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-170	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	хінолін-3-іл
XXIX-171	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-172	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-173	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-174	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-175	4-фторцинаміл	H F	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-176	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	бензотіофен-2-іл
XXIX-177	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-178	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-179	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-180	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-181	4-фторцинаміл	H F	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-182	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	5-нітро-[1H]-піразол-3-іл
XXIX-183	4-хлорцинаміл	H F	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-184	4-хлорцинаміл	H Cl	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-185	4-хлорцинаміл	Br H	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-186	4-фторцинаміл	H Cl	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-187	4-фторцинаміл	H F	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-188	4-фторцинаміл	Br H	C(O)	(1H)-тетразол-1-іл)метил
XXIX-189	4-хлорцинаміл	H Cl	за'явок	бензил
XXIX-190	4-хлорцинаміл	H F	за'явок	бензил
XXIX-191	4-хлорцинаміл	Br H	за'явок	бензил
XXIX-192	4-фторцинаміл	H Cl	за'явок	бензил

Сполука	R ⁴	R ^{4a} R ^{4b}	Y	R ¹
XXIX-193	4-фторцинамід	H F	зв'язок	бензил
XXIX-194	4-фторцинамід	Br H	зв'язок	бензил
XXIX-195	4-хлорцинамід	H F	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-196	4-хлорцинамід	H Cl	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-197	4-хлорцинамід	Br H	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-198	4-фторцинамід	H Cl	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-199	4-фторцинамід	H F	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-200	4-фторцинамід	Br H	C(O)	(4-ціанофеніл)аміно
XXIX-201	4-хлорцинамід	H Me ₂ SiCC	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXIX-202	4-фторцинамід	H Me ₂ SiCC	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXIX-203	4-хлорцинамід	H Me ₂ SiCC	зв'язок	карбометокси
XXIX-204	4-фторцинамід	H Me ₂ SiCC	зв'язок	карбометокси
XXIX-205	4-хлорцинамід	H Me ₂ SiCC	зв'язок	ацетил
XXIX-206	4-фторцинамід	H Me ₂ SiCC	зв'язок	ацетил
XXIX-207	4-хлорцинамід	H OMe	SO ₂	n-бутил
XXIX-208	4-хлорцинамід	H F	SO ₂	n-бутил
XXIX-209	4-хлорцинамід	H Cl	SO ₂	n-бутил
XXIX-210	4-хлорцинамід	Br H	SO ₂	n-бутил
XXIX-211	4-фторцинамід	H OMe	SO ₂	n-бутил
XXIX-212	4-фторцинамід	H Cl	SO ₂	n-бутил
XXIX-213	4-фторцинамід	H F	SO ₂	n-бутил
XXIX-214	4-фторцинамід	Br H	SO ₂	n-бутил

У таблиці XXX представлена 121 сполука формули Iad



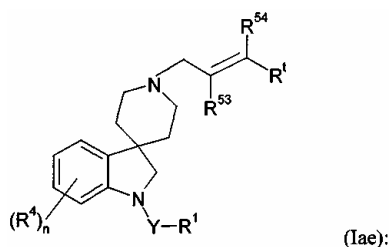
Таблиця XXX

Спол.	(R ⁴) _n	R ³³ R ³⁴	(R ⁵) _n	Y	R ¹
XXX-1	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-2	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-3	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-4	6-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-5	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-6	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-7	6-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-8	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-9	7-O-Ph	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-10	7-O-Ph	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил

Спол.	(R ⁴) _n	R ³³ R ³⁴	(R ⁵) _n	Y	R ¹
XXX-11	5-OC ₂ H ₅ CH ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-12	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дибромпірид-4-ил
XXX-13	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дихлорпірид-4-ил
XXX-14	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	пірид-3-ил
XXX-15	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дибромпірид-4-ил
XXX-16	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дихлорпірид-4-ил
XXX-17	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	пірид-3-ил
XXX-18	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дибромпірид-4-ил
XXX-19	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дихлорпірид-4-ил
XXX-20	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	пірид-3-ил
XXX-21	6-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2,6-дибромпірид-4-ил
XXX-22	6-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	3,5-дихлорпірид-4-ил
XXX-23	4-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	4,6-диметоксипіримідин-2-іл
XXX-24	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	4,6-диметоксипіримідин-2-іл
XXX-25	6-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-3-ил
XXX-26	7-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-3-ил
XXX-27	6-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-3-ил
XXX-28	4-OCF ₂ CHF ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-3-ил
XXX-29	5-O-(4-трифторметил-феніл)	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-30	5-OCF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-31	5-F	H H	4-F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-32	5-Cl	H H	2,4-Cl ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-33	5,7-Cl ₂	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-34	7-Cl	H H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-35	7-Cl	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-36	5,7-диметил	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-37	4,7-диметил	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-38	6-CF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-39	4,6-Cl ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-40	4,6-Cl ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-41	5-ізопропіл	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-42	5-Br	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-43	6,7-диметил	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-44	5,6-Cl ₂	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-45	4-CF ₃	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-46	7-CH ₂ Cl	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-47	7-Br	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-48	5-мет-бутил	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-49	4,6-диметил	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-50	4-CF ₃ -7-Cl	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-51	5-Cl	H H	4-CF ₃	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-52	5-Cl	H H	4-CH=CH ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
Спол.	(R ⁴) _n	R ³³ R ³⁴	(R ⁵) _n	Y	R ¹
XXX-53	5-Cl	H H	4-CF ₃	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-54	5-Cl	H H	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-55	5-Cl	H H	4-NO ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-56	5-Cl	H H	3,5-(CF ₃) ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-57	5-Cl	H H	3-Br	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-58	5-Cl	H H	3-етокси	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-59	5-Cl	H H	2-Me	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-60	5-Cl	H H	4-Me	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-61	5-Cl	H H	3-Cl,4-F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-62	5-Cl	H H	3,5-Cl ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-63	5-Cl	H H	4-N ₃	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-64	5-Cl	H H	2-Br	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-65	5-Cl	H H	2,6-диметокси	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-66	5-Cl	H H	4-етокси	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-67	5-Cl	H H	3-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-68	5-Cl	H H	3-Me,4-OMe,5-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-69	5-Cl	H H	4-OPh	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-70	5-Cl	H H	4-CN	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-71	5-Cl	H H	3-F,4-Ph	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-72	5-Cl	H H	4-SMe	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-73	5-Cl	H H	3-Br	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-74	5-Cl	H H	4-F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-75	5-Cl	H H	4-Br	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-76	5-Cl	H H	2,4-Cl ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-77	5-Cl	H H	2,4-F ₂	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-78	5-Cl	H H	3-CF ₃	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-79	5-Cl	H H	3,4-диетокси	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-80	5-Cl	H H	3-Me,4-F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-81	5-Cl	H H	4-Ph	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-82	5-Cl	H Me	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-83	5-Cl	H Me	4-Cl	C(O)	Me
XXX-84	5-Cl	H Me	4-F	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-85	5-Cl	H Me	4-F	C(O)	Me
XXX-86	5-Cl	H H	4-OCF ₃	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-87	5-Cl	H H	4-OCF ₃	C(O)	Me
XXX-88	5-Cl	H F	H	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-89	5-Cl	H F	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-90	5-Cl	H F	4-Cl	C(O)	Me
XXX-91	5-Cl	H CF ₃	4-Cl	C(O)	2-хлорпірид-4-ил
XXX-92	5-Cl	H CF ₃	4-Cl	C(O)	Me
XXX-93	5-F	H H	4-Cl	C(O)	імідазол-1-іл

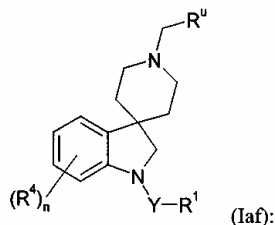
Спол.	(R ⁴) _n	R ⁵³	R ⁵⁴	(R ⁵) _n	Y	R ¹
XXX-94	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	NH ₂
XXX-95	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCO-2-хлорпирид-4-ил
XXX-96	5-Cl	H	H	4-NO ₂	C(O)	Me
XXX-97	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	NHCO-4-трифторметоксифеніл
XXX-98	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCO-пирид-4-ил
XXX-99	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCO-3-хлорпирид-4-ил
XXX-100	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCONH-4-трифторметоксифеніл
XXX-101	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCONH-3-хлорфеніл
XXX-102	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	-N=C(Me)NMe ₂
XXX-103	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCONH-4-трифторметилфеніл
XXX-104	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-ізопропіл
XXX-105	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ OMe
XXX-106	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NHCH ₂ -пирид-3-ил
XXX-107	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ OH
XXX-108	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ -морфолініл
XXX-109	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NHCH ₂ -пирид-4-ил
XXX-110	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-етил
XXX-111	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-метил
XXX-112	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-бензил
XXX-113	5-Cl	F	H	4-Cl	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXX-114	5-Cl	F	H	4-CF ₃	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXX-115	5-Cl	H	Cl	4-Cl	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXX-116	5+6 -O-CF ₂ -O-	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-117	5+6 -O-CF ₂ -O-	H	H	4-Cl	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXX-118	5+6 -O-CH ₂ -O-	H	H	4-Cl	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXX-119	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	-NHCONH-4-хлорфеніл
XXX-120	5-F	H	H	4-Cl	зв'язок	етил
XXX-121	5-Cl	H	H	4-Cl	зв'язок	NO

У таблиці XXXI представлено 8 сполук формули Iaе



Спол.	(R ⁴) _n	R ⁵³	R ⁵⁴	R ¹	Y	R ¹
XXXI-1	5-Cl	H	H	5-трифторметил-пирид-2-ил	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-2	5-F	H	H	5-хлоріофен-2-іл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-3	5-Cl	H	H	тіофен-2-іл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-4	5-Cl	H	H	нафт-2-ил	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-5	5-Cl	H	H	-CH=CH-феніл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-6	5-Cl	H	H	бензотіофен-2-іл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-7	5-Cl	H	H	-CH=CH-4-хлорфеніл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXI-8	5-Cl	H	H	Br	C(O)	2-хлорпирид-4-ил

У таблиці XXXII представлено 10 сполук формули Iaф



Спол.	(R ⁴) _n	R ^u	Y	R ¹
XXXII-1	5-Cl	4-F-Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-2	5-Cl	4-OCF ₃ -Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-3	5-Cl	4-Cl-Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-4	5-F	6-F-нафт-2-ил	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-5	5-Cl	-CH(OH)CH ₂ O-4-Cl-Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-6	5-Cl	-C(Me)=NO-Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-7	5-Cl	5-Cl-бензоксазол-2-іл	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-8	5-Cl	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил
XXXII-9	5-Cl	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил

Спол.	(R ⁴) _n	R ^u	Y	R ¹
XXXII-10	5-Cl	(2-етилтетразол-5-іл)-4-Ph	C(O)	2-хлорпирид-4-ил

Дані мас-спектрометричного (МС) аналізу вибірових сполук з таблиць I-XXIX одержували з використанням апаратури Micromass Platform 2. Ці дані наведені нижче в таблиці 4.

Таблиця 4

Сполука №	Дані МС	Сполука №	Дані МС	Сполука №	Дані МС
I-1	444 (95%), 446 (100%), 480 (70%), 482 (15%)	I-92	556 (55%), 558 (100%), 560 (40%), 562 (8%)	I-242	526 (100%), 528 (99%), 530 (35%), 532 (5%)
I-2	462 (100%), 464 (95%), 489 (100%), 491 (70%)	I-112	556 (55%), 558 (100%), 560 (40%), 562 (8%)	I-252	526 (100%), 528 (90%), 530 (35%), 532 (5%)
I-3	512 (95%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)	I-132	546 (75%), 548 (100%), 550 (40%), 552 (10%)	I-262	526 (95%), 528 (100%), 530 (35%), 532 (5%)
I-4	512 (95%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)	I-142	514 (100%), 516 (70%), 518 (15%)	I-282	572 (100%), 574 (80%), 576 (20%)
I-12	512 (95%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)	I-152	530 (97%), 532 (100%), 534 (40%), 536 (5%)	I-292	562 (100%), 564 (40%), 566 (15%)
I-21	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)	I-162	530 (100%), 532 (97%), 534 (40%), 536 (5%)	II-22	431 (100%), 433 (60%), 435 (15%)
I-22	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)	I-171	512 (98%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)	II-62	415 (100%), 417 (35%)
I-23	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)	I-182	604 (100%), 606 (70%), 608 (15%)	V-21	381 (100%), 383 (35%)
I-32	496 (100%), 498 (80%), 500 (20%)	I-192	508 (100%), 510 (80%), 512 (20%)	V-22	415 (100%), 417 (70%), 419 (15%)
I-52	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)	I-202	492 (100%), 494 (70%), 496 (15%)	V-62	399 (100%), 401 (40%), 403 (15%)
I-61	496 (100%), 498 (80%), 500 (20%)	I-212	503 (100%), 505 (70%), 507 (15%)	V-192	411 (100%), 413 (60%), 415 (15%)
I-62	496 (100%), 498 (80%), 500 (20%)	I-222	502 (100%), 504 (70%), 506 (15%)	V-202	395 (100%), 397 (80%)
I-72	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)	I-232	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)	VI-1	410 (100%)
I-82	496 (100%), 498 (75%), 500 (15%)			VI-22	478 (100%), 480 (70%), 482 (15%)
IX-62	435 (100%), 437 (40%)	XXVI-2	494 (100%), 496 (100%), 498 (20%)	VI-62	462 (100%), 464 (30%), 466 (10%)
X-22	459 (100%), 461 (75%), 463 (15%)	XXVI-22	528 (100%), 530 (97%), 532 (30%), 534 (5%)	VI-101	488 (100%), 490 (100%), 492 (10%)
X-62	443 (100%), 445 (40%)	XXVIII-7	523 (100%), 525 (80%), 527 (20%)	VI-202	458 (100%), 460 (30%), 462 (10%)
XI-62	467 (100%), 469 (40%)	XXVIII-27	519 (100%), 521 (40%), 523 (40%)	XXIX-69	479 (100%), 481 (70%), 483 (15%)
XII-22	478 (100%), 480 (75%), 482 (35%), 484 (5%)	XXVIII-42	565 (100%), 567 (40%), 569 (15%)	XXIX-75	512 (95%), 514 (100%), 516 (40%), 518 (5%)
XIII-22	471 (100%), 473 (70%), 475 (15%)	XXVIII-67	495 (100%), 497 (70%), 499 (10%)	XXIX-81	485 (100%), 487 (75%), 489 (20%)
XIII-62	455 (100%), 457 (35%)	XXVIII-97	502 (100%), 504 (70%), 506 (10%)	XXIX-87	526 (100%), 528 (70%), 530 (10%)
XIV-22	451 (100%), 453 (70%), 455 (15%)	XXVIII-132	503 (100%), 505 (40%), 507 (10%)	XXIX-93	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)
XV-22	528 (100%), 530 (70%), 532 (10%)	XXVIII-162	537 (100%), 539 (40%), 541 (10%)	XXIX-99	512 (95%), 514 (100%), 516 (30%), 518 (5%)
XVII-62	533 (100%), 535 (40%)	XXVIII-187	589 (95%), 591 (100%), 593 (40%), 595 (5%)	XXIX-105	560 (100%), 562 (70%), 564 (15%)
XVIII-22	555 (100%), 557 (80%), 559 (20%)	XXVIII-217	535 (100%), 537 (70%), 539 (10%)	XXIX-111	482 (100%), 484 (70%), 486 (15%)
XVIII-202	535 (100%), 537 (40%)	XXVIII-252	475 (100%), 477 (40%)	XXIX-117	373 (100%), 375 (70%), 377 (15%) 492 (20%), 494 (15%)
XIX-22	502 (100%), 504 (70%), 506 (10%)	XXIX-1	492 (100%), 494 (70%), 496 (15%)	XXIX-123	497 (100%), 499 (75%), 501 (15%)
XIX-202	482 (100%), 484 (40%)	XXIX-7	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)	XXIX-129	469 (100%), 471 (70%), 473 (15%)
XX-22	521 (100%), 523 (75%), 525 (15%)	XXIX-13	476 (100%), 478 (80%), 480 (20%)	XXIX-135	472 (100%), 474 (70%), 476 (15%)
XX-62	505 (100%), 507 (40%)	XXIX-19	458 (100%), 460 (85%), 462 (15%)	XXIX-141	570 (100%), 572 (75%), 574 (15%)
XXI-22	557 (100%), 559 (70%), 561 (15%)	XXIX-31	528 (100%), 530 (97%), 532 (30%), 534 (5%)	XXIX-147	532 (100%), 534 (80%), 536 (20%)
XXI-62	541 (100%), 543 (40%)	XXIX-37	556 (100%), 558 (70%), 560 (15%)	XXIX-153	522 (100%), 524 (75%), 526 (15%)
XXII-22	526 (100%), 528 (97%), 530 (30%), 532 (5%)	XXIX-43	470 (100%), 472 (100%), 474 (100%), 476 (30%)	XXIX-159	465 (100%), 467 (40%), 469 (10%)
XXV-62	357 (100%), 359 (55%)	XXIX-49	251 (100%), 307 (70%)	XXIX-165	512 (100%), 514 (40%), 516 (10%)
XXV-222	363 (100%), 365 (30%)			XXIX-171	517 (100%), 519 (40%), 521 (10%)
XXVI-1	460 (100%), 462 (100%)			XXIX-177	427 (100%), 496 (80%), 498 (30%)

Сполука №	Дані МС
XXIX-183	467 (100%), 469 (35%)
XXIX-189	463 (100%), 465 (55%), 467 (15%)

Сполука №	Дані МС
XXIX-195	501 (100%), 503 (40%)
XXIX-196	517 (100%), 519 (70%), 521 (15%)

Сполука №	Дані МС
XXIX-201	574 (100%), 576 (80%), 578 (20%)
XXIX-207	489 (100%), 491 (40%)

Дані мас-спектрометричного (МС) аналізу вибіркового сполук з таблиць XXX-XXXП одержували з використанням РХ/МС: LC5: 254нм, градієнтне елюювання із зміною пропорції елюентів від 10% елюенту А до 100% елюенту Б, елюент А: $\text{H}_2\text{O}+0,01\% \text{ HCOOH}$, елюент Б: $\text{CH}_3\text{CN}/\text{CH}_3\text{OH}+0,01\% \text{ HCOOH}$, іонізація методом електроспрею з позитивними іонами (ES+) 150-1000 m/z. Отримані дані представлені нижче в таблиці 5.

Таблиця 5

Сполука	$t_{\text{м}} (^{\circ}\text{C})$	РХ/МС (час утримання, хв)	РХ/МС (М+Н)
XXX-1		2'27	465
XXX-2		2'55	562
XXX-3		2'26	465
XXX-4		2'30	497
XXX-5		2'30	497
XXX-6		2'48	562
XXX-7		2'48	594
XXX-8		2'51	594
XXX-9		2'28	473
XXX-10		2'43	570
XXX-11		2'26	522
XXX-12		2'57	686
XXX-13		2'56	596
XXX-14		2'09	528
XXX-15		2'60	718
XXX-16		2'71	630
XXX-17		2'22	560
XXX-18		2'66	686
XXX-19		2'64	596
XXX-20		2'29	528
XXX-21		2'68	718
XXX-22		2'68	630
XXX-23		2'43	589
XXX-24		2'53	621
XXX-25		2'30	562
XXX-26		2'33	562
XXX-27		2'35	594
XXX-28		2'42	594
XXX-29		2'60	638
XXX-30			562
XXX-31			480
XXX-32			546
XXX-33	171-172	2' 27	449

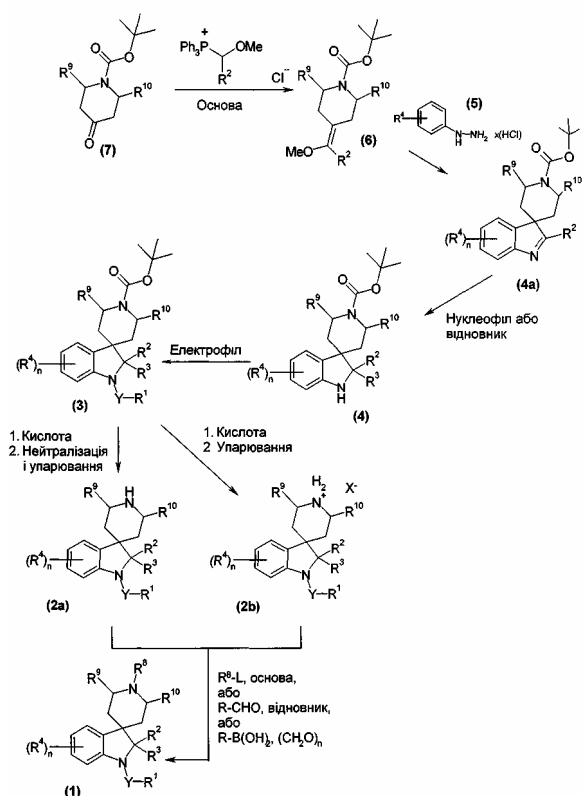
Сполука	$t_{\text{м}} (^{\circ}\text{C})$	РХ/МС (час утримання, хв)	РХ/МС (М+Н)
XXX-34	59-61	2' 01	415
XXX-35	182-184	2' 33	512
XXX-36	158-160	2' 43	506
XXX-37	199-201	2' 42	506
XXX-38		2' 48	546
XXX-39	157-159	2' 52	546
XXX-40		2' 46	546
XXX-41		2' 47	520
XXX-42	140-142	2' 37	556
XXX-43	106-110	2' 39	506
XXX-44		2' 53	546
XXX-45	170-172	2' 39	546
XXX-46	146-148	2' 36	506
XXX-47	196-198	2' 31	556
XXX-48	149-151	2' 49	534
XXX-49	194-196	2' 33	506
XXX-50	165-167	2' 48	580
XXX-51			546
XXX-52			504
XXX-53			546
XXX-54			513
XXX-55			523
XXX-56			614
XXX-57			557
XXX-58			522
XXX-59			492
XXX-60			492
XXX-61			531
XXX-62			547
XXX-63			533
XXX-64			557
XXX-65			538
XXX-66			522

Сполука	$t_{\text{м}} (^{\circ}\text{C})$	РХ/МС (час утримання, хв)	РХ/МС (М+Н)
XXX-67			513
XXX-68			557
XXX-69			571
XXX-70			503
XXX-71			573
XXX-72			525
XXX-73			557
XXX-74			496
XXX-75			557
XXX-76			547
XXX-77			514
XXX-78			546
XXX-79			538
XXX-80			510
XXX-81			555
XXX-82		2'45	528
XXX-83		2'22	429
XXX-84		2'30	510
XXX-85		2'05	413
XXX-86	70	2'40	562
XXX-87		2'27	465
XXX-88		2'22	497
XXX-89		2'44	530
XXX-90		2'15	433
XXX-91			
XXX-92		2'53	483
XXX-93		1'93	451
XXX-94		1'74	372
XXX-95		2'08	511
XXX-96		1'93	426
XXX-97		2'57	576
XXX-98		1'99	493
XXX-99		2'20	527
XXX-100		2'55	575
XXX-101		2'46	525
XXX-102		1'45	457
XXX-103		2'60	575
XXX-104		2'13	442
XXX-105		1'96	458
XXX-106		1'67	491
XXX-107		1'86	444
XXX-108		1'41	513
XXX-109		1'55	491
XXX-110		2'00	428
XXX-111		1'90	414
XXX-112		2'31	490
XXX-113		2'74	530
XXX-114		2'44	520
XXX-115		2'53	548
XXX-116		2'20	461
XXX-117		2'47	558
XXX-118		2'17	522
XXX-120			399
XXX-121		2'05	427

Сполука	$t_{\text{м}} (^{\circ}\text{C})$	РХ/МС (час утримання, хв)	РХ/МС (М+Н)
XXXI-1			547
XXXI-2	147-148		
XXXI-3			484
XXXI-4			528
XXXI-5			504
XXXI-6			535
XXXI-7			539
XXXI-8		1'86	482
XXXII-1			470
XXXII-2			536
XXXII-3			486
XXXII-4			504
XXXII-5			546
XXXII-6			509
XXXII-7			527
XXXII-8			2'27
XXXII-9			1'96
XXXII-10			2'21

Запропоновані у винаході сполуки можна одержувати різними шляхами. Так, наприклад, їх можна одержувати за реакціями, які в узагальненому вигляді представлені на схемі І.

Схема I



Відповідно до цієї схеми сполуку формули 1 можна синтезувати зі сполук формули 2a або 2b їх взаємодією з алкілувальним агентом формули R^8-L , де L являє собою хлорид, бромід, йодид або сульфонат (наприклад мезилат або тозилат) або аналогічну групу, яка вилучається, при температурі в інтервалі від кімнатної температури до 100°C , звичайно при 65°C , в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності третинного аміну, такого як триетиламін або діізопропілетиламін, і необов'язково при каталізі галогенідами, такими як йодид натрію, йодид калію або йодид тетрабутиламонію.

В іншому варіанті сполуку формули 2a або 2b можна піддавати взаємодії з альдегідом формули $RCHO$ при температурі в інтервалі від кімнатної температури до 100°C в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або етанол, або в суміші розчинників у присутності відновника, такого як боран-піридиновий комплекс, боргідрид натрію, (триацетокси)боргідрид натрію, ціаноборгідрид натрію або подібний до них відновник, з одержанням сполуки формули 1, де R^8 являє собою CH_2-R .

В іншому варіанті сполуку формули 2a або 2b можна піддавати взаємодії з параформальдегідом і бороноювою кислотою формули $R-B(OH)_2$ при температурі в інтервалі від кімнатної до 100°C в органічному розчиннику, такому як етанол, 1,4-діоксан або вода, з одержанням сполуки формули 1, де R^8 являє собою CH_2-R .

Сполуку формули 2a можна одержувати із сполуки формули 3 її взаємодією з кислотою, такою як трифтороцтова кислота, при кімнатній

температурі в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, з наступною нейтралізацією реакційної суміші водним розчином неорганічної основи, такої як карбонат натрію, бікарбонат натрію або аналогічна сполука.

Аналогічним чином сполуку формули 2b можна одержувати взаємодією сполуки формули 3 з кислотою, такою як трифтороцтова кислота, при кімнатній температурі в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, з наступним випарюванням розчинників і розтиранням з органічними розчинниками, такими як простий ефір або гексан.

Сполуки формули 3 можна одержувати зі сполук формули 4 шляхом електрофільного заміщення їх взаємодією з відповідним реагентом. Сполуки формули 3, у якій Y являє собою карбонільну групу, можна одержувати взаємодією сполук формули 4 з похідним карбонової кислоти формули $R^1-C(O)-Z$, де Z являє собою хлорид, гідроксигрупу, алкоксигрупу або ацилоксигрупу, при температурі від 0 до 150°C , необов'язково в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, необов'язково в присутності третинного аміну, такого як триетиламін або діізопропілетиламін, і необов'язково у присутності агента сполучення, такого як дициклогексилкарбодіімід. Сполуки формули 3, у якій Y являє собою карбонільну групу, а R^1 являє собою амінозамісник формули $R'-NH-$, можна одержувати в аналогічних умовах взаємодією сполук формули 4 з ізоціанатом формули $R'-N=C=O$. Сполуки формули 3, у якій Y являє собою групу формули $S(O)_q$, можна одержувати в аналогічних умовах зі сполук формули 4 їх обробкою сполуками формули $R^1-S(O)_q-Cl$. Сполуки формули 3, у якій Y являє собою тіокарбонільну групу, а R^1 являє собою амінозамісник формули $R'-NH-$, можна одержувати в аналогічних умовах взаємодією сполук формули 4 з ізотіоціанатом формули $R'-N=C=S$. В іншому варіанті сполуки формули 3, у якій Y являє собою тіокарбонільну групу, а R^1 являє собою вуглецевий замісник, можна одержувати обробкою сполук формули 3, у якій Y являє собою карбонільну групу, а R^1 являє собою вуглецевий замісник, прийнятим сіркувальним агентом, таким як реагент Лавессона (Lawesson).

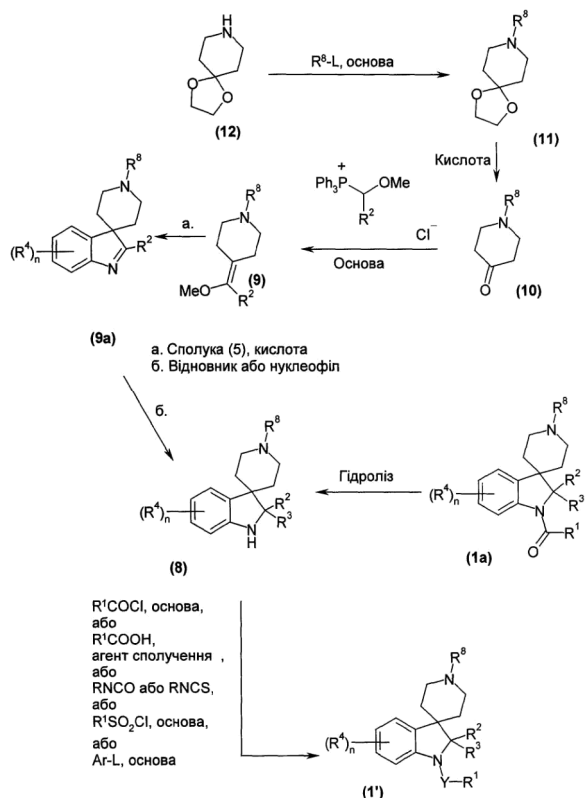
Використовувані при проведенні описаних вище реакцій похідні кислоти формули $R'-QCO-Z$, ізоціанати формули $R'-N=C=O$, ізотіоціанати формули $R'-N=C=S$ і сірчані електрофіли формули $R^1-S(O)_q-Cl$ або є відомими сполуками, або їх можна одержувати з відомих сполук відомими фахівцям методами.

Сполуки формули 4 можна одержувати взаємодією сполук формули 5 із сполуками формули 6 при температурі від 0 до 100°C в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності кислоти, такої як соляна кислота або трифтороцтова кислота, і співрозчинника, такого як вода, метанол або етанол, або в присутності металевої солі кислоти Л'юїса, такий як дигалогенід цинку(II). Проміжні сполуки, які

Інші методи одержання сполук формули 1' (сполук формули I, у якій R^2 , R^3 , R^9 і R^{10} означають водень) проілюстровані нижче на схемі II.

Проміжні сполуки, які утворюються, (сполуки формули (9a)) потім обробляють при кімнатній температурі в органічному розчиннику, такому як етанол або хлороформ, відновником, таким як

Схема II



Відповідно до цієї схеми сполуку формули 1' можна одержувати зі сполуки формули 8 її взаємодією з хлорангідридом кислоти або хлорформіатом формули R'COCl при температурі в інтервалі від 0°C до кімнатної в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності третинного

боргідрид натрію, (триацетокси)боргідрид натрію, ціаноборгідрид натрію або аналогічний відновник.

Сполуки формули 8 можна також одержувати шляхом гідролізу сполук формули 1a (які також утворюють підгрупу сполук формули I), переважно водною кислотою, звичайно бн. соляною кислотою, при температурі перегонки.

Сполуки формули 9 можна одержувати зі сполук формули 10 їх взаємодією з хлоридом метоксиметил(трифеніл)фосфонію або відповідним бромідом і основою, такою як трет-бутоксид калію, при температурі в інтервалі від 0°C до кімнатної в тетрагідрофурани.

Сполуки формули 10 можна одержувати взаємодією сполук формули 11 з водним розчином кислоти, звичайно бн. соляної кислоти, при температурі перегонки.

Сполуки формули 11 можна одержувати зі сполук формули 12 їх взаємодією з електрофілом формули R^8-L , де L являє собою хлорид, бромід, йодид або сульфат (наприклад мезилат або тозилат) або аналогічну групу, яка вилучається, при температурі в інтервалі від кімнатної до 100°C, звичайно при температурі близько 60°C, в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності надлишку третинного аміну, такого як триетиламін або діізопропілетиламін, і необов'язково при каталізі галогенідами, такими як йодид натрію, йодид калію або йодид тетрабутиламону.

Сполуки формули 12 є відомими сполуками або їх можна одержувати з відомих сполук відомими методами.

Деякі сполуки формул 8, 9, 9a, 10 і 11 є новими і відповідно до цього становлять ще один об'єкт винаходу.

Для фахівця в даній галузі очевидно, що одну сполуку формули I можна взаємоперетворювати в інші сполуки формули I методами, деякі приклади яких представлені нижче на схемах III, IV, V, Va і VI.

Схема III

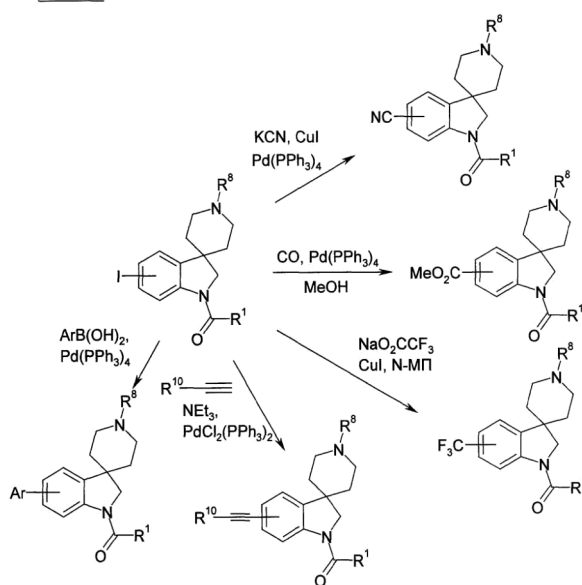


Схема IV

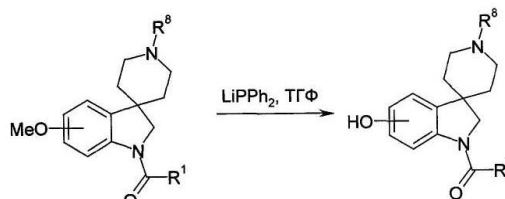


Схема V

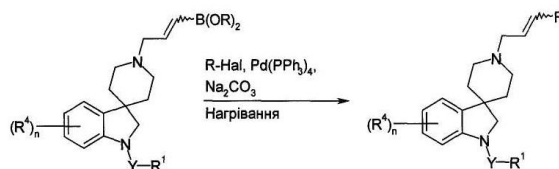


Схема VA

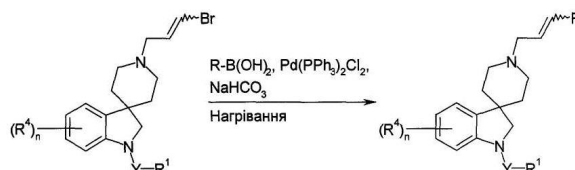
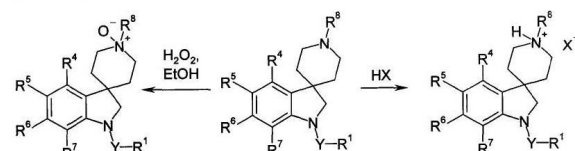
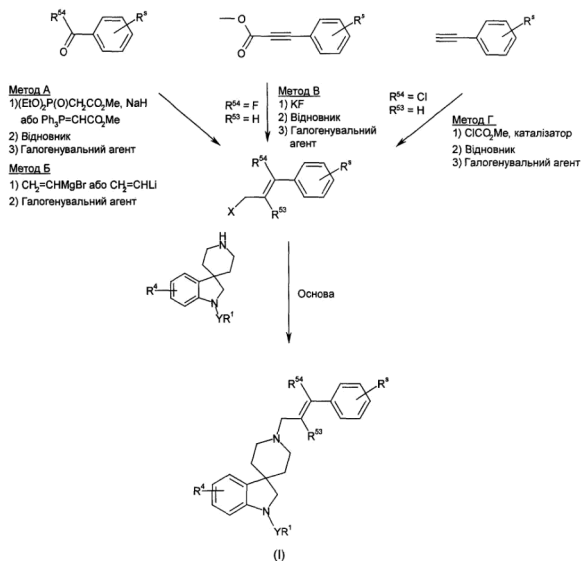


Схема VI



Сполуки формули I, у якій R^8 означає необов'язково заміщений цинаміл, можна одержувати за реакціями, представленими нижче на схемі VII, де R^4 , R^{53} , R^{54} і R^5 мають вищевказані значення. Конкретні приклади проілюстрованих на цій схемі реакцій описані в прикладах 8-12.

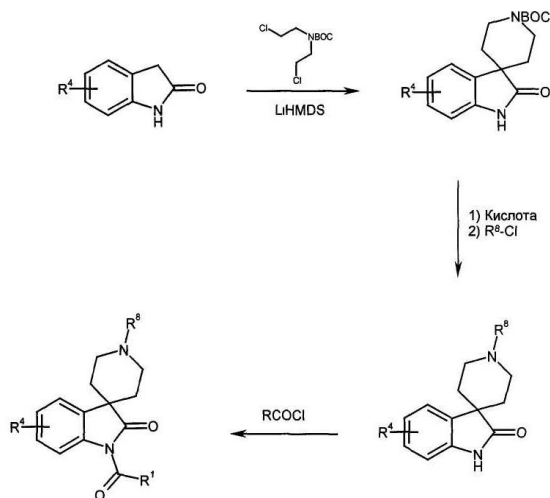
Схема VII



Сполуки формули (I), у якій R^2 і R^3 спільно означають оксогрупу, а R^1 , R^4 і R^8 мають вказані вище значення, можна одержувати методами,

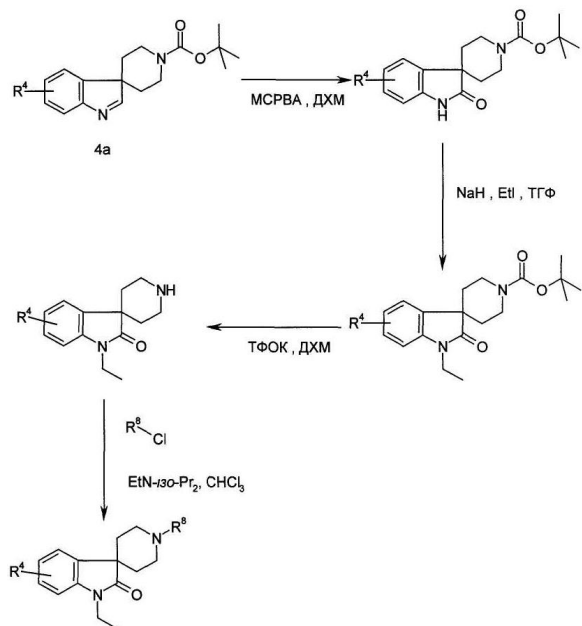
описаними в WO 01/45707 і проілюстрованими нижче на схемі VIII.

Схема VIII



Сполуки формули (I), у якій R^2 і R^3 спільно означають оксогрупу, а R^8 має вказані вище значення, можна одержувати зі сполук формули 4a методами, проілюстрованими нижче на схемі IX.

Схема IX



Сполуки формули (I) можуть використовуватися для боротьби з комахами-шкідниками і для захисту від зараження ними, такими як лускокрилі (Lepidoptera), двокрилі (Diptera), напівтвердокрилі клопи (Hemiptera), пухири (Thysanoptera), прямокрилі (Orthoptera), Dictyoptera, твердокрилі (Coleoptera), блохи (Siphonaptera), перетинчастокрилі (Hymenoptera) і терміти (Isoptera), а також для боротьби з іншими безхребетними шкідниками і паразитами, наприклад кліщами, нематодами і молюсками. Усі такі комахи, кліщі, нематоли і молюски в

наступному описі названі збірним терміном "шкідники". Запропоновані у винаході сполуки можуть використовуватися для боротьби зі шкідниками в агротехнічному секторі (включаючи вирощування і продовольчих культур, і волокнистих культур), у садівничому секторі й у тваринницькому секторі, у секторі, зв'язаному з розведенням тварин, у лісівничому секторі й у секторі, зв'язаному зі зберіганням продуктів рослинного походження (таких як плоди, зерно і лісоматеріали), зі шкідниками, які пошкоджують штучні і конструкції, і зі шкідниками-переносниками хвороб людини і тварин, а також з "дошкуляючими" людям і тваринам комахами (такими як мухи).

Як приклад шкідників, боротися з якими можна за допомогою сполук формули (I), можна назвати *Myzus persicae* (попелиця), *Aphis gossypii* (попелиця), *Aphis fabae* (попелиця), *Lygus* spp. (клопи), *Dysdercus* spp. (клопи), *Nilaparvata lugens* (дельфацид), *Nephotettix inciticeps* (цикадка), *Nezara* spp. (щитники), *Euschistus* spp. (щитники), *Leptocoris* spp. (щитники), *Frankliniella occidentalis* (thrip), *Thrips* spp. (трипси), *Leptinotarsa decemlineata* (колорадський жук), *Anthonomus grandis* (довгоносик бавовняний), *Aonidiella* spp. (червці), *Trialeurodes* spp. (білокрилки), *Bemisia tabaci* (білокрилка), *Ostrinia nubilalis* (метелик кукурудзяний), *Spodoptera littoralis* (гусениця совки бавовняної), *Heliothis virescens* (гусениця тютюнової листовійки-брунькоїда), *Helicoverpa armigera* (коробковий черв'як), *Helicoverpa zea* (коробковий черв'як), *Sylepta derogata* (листовійка бавовняна), *Pieris brassicae* (капустяниця), *Plutella xylostella* (міль капустяна), *Agrotis* spp. (совки), *Chilo suppressalis* (свердлик рисовий стебловий), *Locusta migratoria* (сарана), *Chortiocetes terminifera* (сарана), *Diabrotica* spp. (листоїди), *Panonychus ulmi* (кліщ червоний плодовий), *Panonychus citri* (кліщ червоний цитрусовий), *Tetranychus urticae* (кліщ двоплямистий павутинний), *Tetranychus cinnabarinus* (кліщ павутинний червоний), *Phyllocoptruta oleivora* (кліщ іржастий (іржавий) цитрусовий), *Polyphagotarsonemus latus* (широкий кліщ), *Brevipalpus* spp. (плоскі кліщі), *Voophilus microplus* (кліщ боофілюс), *Dermacentor variabilis* (іксодовий кліщ собачий), *Stenocephalus scaber* (кліщ двоплямистий павутинний), *Liriomyza* spp. (мініюючі мушки), *Musca domestica* (муха кімнатна), *Aedes aegypti* (комар), *Anopheles* spp. (кровосисні комари), *Culex* spp. (кровосисні комари), *Lucilia* spp. (м'ясні мухи), *Blattella germanica* (тарган), *Periplaneta americana* (тарган), *Blatta orientalis* (тарган), терміти родини *Mastotermitidae* (наприклад *Mastotermes* spp.), родини *Kalotermitidae* (наприклад *Neotermes* spp.), родини *Rhinotermitidae* (наприклад *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* і *R. santonensis*) і родини *Termitidae* (наприклад *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (вогненна мураха), *Monomorium pharaonis* (фараонів мураха), *Damalinia* spp. і *Linognathus* spp. (пухоїди і воші відповідно), *Meloidogyne* spp. (кореневі нематоли), *Globodera* spp. і *Heterodera* spp. (гетеродериди), *Pratylenchus* spp. (нематоли, які пошкоджують), *Rhodopholus* spp. (бананові норові або

свердлувальні нематоди), *Tylenchulus* spp. (цитрусові нематоди), *Haemonchus contortus* (гемонхус), *Caenorhabditis elegans* (оцтова нематода), *Trichostrongylus* spp. (шлунково-кишкові нематоди) і *Deroceras reticulatum* (слизень).

Відповідно до цього у винаході пропонується спосіб боротьби з комахами, кліщами, нематодами або молюсками, які полягає в обробці шкідника, місця його заселення або рослини, підданої ураженню шкідником, інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективною кількістю сполуки формули (I) або композиції, яка містить сполуку формули (I). Сполуки формули (I) переважно використовувати для боротьби з комахами, кліщами або нематодами.

Під терміном "рослина" у контексті даного винаходу маються на увазі висіяні рослини або рослини, які висівають, чагарники і дерева.

Звичайно на основі сполуки формули (I) для можливості її застосування як інсектициду, акарициду, нематоциду або молюскоциду з метою обробки нею шкідника, місця його заселення або рослини, підданої ураженню шкідником, шляхом його переробки за технологією приготування препаративних форм готують композицію, до складу якої крім сполуки формули (I) входить також прийнятний інертний розріджувач або носій і необов'язково поверхнево-активна речовина (ПАР). ПАР являють собою хімічні сполуки, які здатні модифікувати властивості межі поділу двох фаз (наприклад межі поділу рідина-тверде тіло, рідина-повітря або рідина-рідина), зменшуючи міжфазний поверхневий натяг і тим самим змінюючи інші властивості (наприклад диспергованість, емульгованість і змочуваність). Вміст сполуки формули (I) у композиціях усіх типів (і у твердих, і в рідких препаративних формах) переважно повинен становити від 0,0001 до 95мас.%, більш переважно від 1 до 85мас.%, наприклад від 5 до 60мас.%. Звичайно при застосуванні композиції для боротьби зі шкідниками норма витрати сполуки формули (I) повинна становити від 0,1г до 10кг на гектар, переважно від 1г до 6кг на гектар, більш переважно від 1г до 1кг на гектар.

При протруєнні насіння норма витрати сполуки формули (I) повинна становити від 0,0001 до 10г (наприклад 0,001г або 0,05г), переважно від 0,005 до 10г, більш переважно від 0,005 до 4г, на кілограм насіння.

Ще одним об'єктом даного винаходу є інсектицидна, акарицидна, нематоцидна або молюскоцидна композиція, яка містить інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективну кількість сполуки формули (I) і придатний для неї носій або розріджувач. Така композиція в переважному варіанті являє собою інсектицидну, акарицидну або нематоцидну композицію.

Наступним об'єктом даного винаходу є спосіб боротьби зі шкідниками в місці їх заселення, який полягає в обробці шкідників або місця їх заселення інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективною кількістю композиції, яка містить сполуку формули (I). У цьому

відношенні сполуки формули (I) переважно використовувати проти комах, кліщів або нематод.

Композиції можна вибирати серед різноманітних типів препаративних форм, включаючи дисти (порошки для обпилювання або опудрювання), розчинні порошки, водорозчинні гранули, вододисперговані гранули, змочувані порошки, гранульовані препарати (з повільним або швидким вивільненням діючої речовини), розчинні концентрати, рідини, які змішуються з маслом, рідини для ультрамалооб'ємного обприскування, емульгувальні концентрати, дисперговані концентрати, емульсії (до яких належать й емульсії типу "масло у воді", і емульсії типу "вода у маслі"), мікроемульсії, суспензійні концентрати, аерозолі, препарати для фумігації/обкурювання, капсульовані суспензії і препарати для протруєння насіння. Той чи інший тип препаративної форми в будь-якому випадку вибирається залежно від конкретної передбачуваної мети його застосування й залежно від фізичних, хімічних і біологічних властивостей сполуки формули (I).

Дисти можна одержувати змішуванням сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами (наприклад природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, глиноземом, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, діатомовими землями, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію і магнею, сіркою, вапном, борошном різних типів, тальком і іншими органічними і неорганічними твердими носіями) і механічним подрібненням отриманої суміші до тонкодисперсного порошку.

Розчинні порошки можна одержувати змішуванням сполуки формули (I) з одним або декількома водорозчинними неорганічними солями (такими як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнею) або з одним або декількома водорозчинними органічними твердими речовинами (такими як полісахарид) і необов'язково з одним або декількома змочувачами, одним або декількома диспергаторами або сумішшю вказаних речовин для поліпшення диспергованості/розчинності у воді. Після цього отриману суміш подрібнюють до тонкодисперсного порошку. Аналогічні композиції можна також гранулювати з одержанням водорозчинних гранул.

Змочувані порошки можна одержувати змішуванням сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами або носіями, з одним або декількома змочувачами і переважно з одним або декількома диспергаторами, а також необов'язково з одним або декількома суспендувальними агентами для полегшення диспергування в рідинах. Отриману суміш потім подрібнюють до тонкодисперсного порошку. Аналогічні композиції можна також гранулювати з одержанням вододиспергованих гранул.

Гранули можна одержувати або гранулюванням суміші сполуки формули (I) і одного або декількох порошкових твердих розріджувачів або носіїв, або попереднім формуванням гранул, які не містять діючу речовину, з наступним абсорбуванням сполуки

формули (I) (або її розчину в прийнятному розчиннику) у пористий гранульований матеріал (такий як пемза, аттапульгіт, фулерова земля, кізельгур, діатомові землі або подрібнені серцевини кукурудзяних качанів) або адсорбуванням сполуки формули (I) (або її розчину у прийнятному розчиннику) у твердий зернистий матеріал (такий як пісок, силікати, мінеральні карбонати, сульфати або фосфати) і при необхідності наступним сушінням. До переліку агентів, які звичайно можуть використовуватися як речовини, які сприяють абсорбції або адсорбції, належать розчинники (такі як аліфатичні й ароматичні петролейні розчинники, спирти, прості ефіри, кетони і складні ефіри) і речовини, які підвищують клейкість (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри і рослинні олії). До складу гранул можна також включати одну або декілька інших добавок (наприклад емульгатор, змочувач або диспергатор).

Дисперговані концентрати можна одержувати розчиненням сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або гліколевий ефір. Такі розчини можуть містити поверхнево-активну речовину (наприклад для поліпшення розведення водою або для запобігання кристалізації в резервуарі обприскувача).

Емульгувальні концентрати або емульсії типу "масло у воді" можна одержувати розчиненням сполуки формули (I) в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або декілька змочувачів, один або декілька емульгаторів або суміш вказаних речовин). До переліку органічних розчинників, які можуть використовуватися для одержання емульгувальних концентратів, належать ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, наприклад продукти SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 і SOLVESSO 200; SOLVESSO є зареєстрованим товарним знаком), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) і спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід жирної кислоти з C₈-C₁₀) і хлоровані вуглеводні. Емульгувальний концентрат здатний практично миттєво емульгуватися при його додаванні у воду з утворенням емульсії, яка має достатню стабільність для можливості її внесення розбризкуванням за допомогою відповідного устаткування. Процес приготування емульсії типу "масло у воді" припускає одержання сполуки формули (I) або у вигляді рідини (якщо вона не є рідкою при кімнатній температурі, то її можна розплавляти при прийнятній температурі, звичайно при температурі нижче 70°C), або у вигляді розчину (її розчиненням у прийнятному розчиннику) з наступним емульгуванням отриманої рідини або розчину в одному або декількох ПАР, що містять воду, при високому зсувному зусиллі з одержанням емульсії. До переліку розчинників, які можуть використовуватися для одержання емульсії типу "масло у воді", належать рослинні олії, хлоровані

вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) і інші прийнятні органічні розчинники, які мають низьку розчинність у воді.

Мікроемульсії можна одержувати змішуванням води із сумішшю одного або декількох розчинників і одного або декількох ПАР безпосередньо з одержанням термодинамічно стабільного ізотропного рідкого препарату. У цьому випадку сполука формули (I) спочатку присутня або у воді, або в суміші розчинника з ПАР. До переліку розчинників, які можуть використовуватися для одержання мікроемульсій, належать ті ж, які й описані вище для застосування в складі емульгувальних концентратів або в емульсіях типу "масло у воді". Мікроемульсія може являти собою систему або типу "масло у воді", або типу "вода в маслі" (конкретний тип системи можна визначати вимірюванням провідності) і придатна для приготування сумішей водорозчинних і маслорозчинних пестицидів у складі тієї ж самої препаративної форми. Мікроемульсію можна розбавляти водою, у результаті чого вона може залишатися у вигляді мікроемульсії або може утворювати традиційну емульсію типу "масло у воді".

Суспензійні концентрати можуть являти собою водні або неводні суспензії тонкоподрібнених нерозчинних твердих частинок сполуки формули (I). Суспензійні концентрати можна одержувати подрібненням твердої сполуки формули (I) у кульовому млині в прийнятному рідкому середовищі, необов'язково з одним або декількома диспергаторами, з одержанням суспензії тонкоподрібнених частинок діючої речовини. До складу композиції подібного типу можна включати один або декілька змочувачів, а також можна включати суспендувальний агент для зменшення швидкості осадження частинок. В іншому варіанті сполуку формули (I) можна розмелювати в сухому стані і потім додавати до води, яка містить описані вище агенти і речовини, з одержанням необхідного кінцевого продукту.

Аерозольні препарати містять сполуку формули (I) і прийнятний пропелент (наприклад н-бутан). Сполуку формули (I) можна також розчиняти або диспергувати у прийнятному рідкому середовищі (наприклад у воді або рідині, яка змішується з водою, наприклад у н-пропанолі) з одержанням композицій, придатних для застосування в ручних помпах для обприскування, у яких робочий розчин не знаходиться під тиском.

Сполуку формули (I) можна змішувати в сухому стані з піротехнічними складами з одержанням композицій, придатної для генерування в закритому просторі диму, який містить діючу речовину.

Метод одержання капсульованих суспензій аналогічний до методу одержання емульсій типу "масло у воді", але передбачає додаткову стадію полімеризації, у результаті якої одержують водну дисперсію масляних крапельок, у якій кожна масляна крапелька знаходиться в полімерній оболонці і містить сполуку формули (I), а також необов'язково містить прийнятний для нього носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна

одержувати або міжфазною поліконденсацією, або в результаті коацервації. Композиції подібного типу можуть забезпечувати контрольоване вивільнення сполуки формули (I) і можуть використовуватися для протруювання насіння. Сполуку формули (I) для забезпечення її уповільненого, контрольованого вивільнення можна також включати в біорозкладну полімерну матрицю.

До складу композиції для поліпшення її біологічної ефективності (наприклад за рахунок поліпшення змочування, утримування або розподілу на поверхні, стійкості до змивання дощем з обробленої поверхні або засвоєності або рухомості сполуки формули (I)) можна також включати одну або декілька добавок. До подібного роду добавок належать поверхнево-активні речовини, які сприяють розпиленню добавки на основі масел, наприклад деяких мінеральних масел або рослинних олій (таких як соєва і рапсова олія), і суміші таких добавок з іншими біополіпшувачими допоміжними речовинами (інгредієнтами, які можуть підвищувати або змінювати дію сполуки формули (I)).

На основі сполуки формули (I) можна також готувати препаративні форми для протруювання насіння, наприклад у вигляді порошкового складу, включаючи порошок для сухого протруювання насіння, водорозчинний порошок або вододиспергований порошок, або у вигляді рідкого складу, включаючи рідкий концентрат, розчин або капсульовану суспензію. Метод одержання порошоків для сухого протруювання насіння, водорозчинних порошоків, вододиспергованих порошоків для напівсухого протруювання насіння, рідких концентратів і розчинів для протруювання насіння багато в чому аналогічний до методу одержання описаних вище композицій у вигляді дуетів, розчинних порошоків, змочуваних порошоків, суспензійних концентратів і диспергованих концентратів відповідно. До складу композицій для протруювання насіння можна також включати агент, які підвищує адгезію композиції до насіння (наприклад мінеральне масло або речовину, яка утворює плівковий бар'єр).

Як змочувачі, диспергатори і емульгатори можуть використовуватися ПАР катіоногенного, аніоногенного, амфотерного або неіоногенного типу.

До прийнятних ПАР катіоногенного типу належать солі четвертинного амонію (наприклад цетилтриметиламонійбромід), імідазоліни і солі амінів.

До прийнятних аніоногенних ПАР належать лужно-металеві солі жирних кислот, солі аліфатичних моноефірів сірчаної кислоти (наприклад лаурилсульфат натрію), солі сульфованих ароматичних сполук (наприклад додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутилнафталінсульфонат і суміші натрію дізопропіл- і тризопропілнафталінсульфонатів натрію), сульфати простих ефірів, сульфати простих ефірів спиртів (наприклад лаурет-3-сульфат натрію), карбоксилати простих ефірів (наприклад лаурет-3-карбоксилат натрію), ефіри

фосфорної кислоти (продукти реакції між одним або декількома жирними спиртами і фосфорної кислотою (переважно складні моноефіри) або пентоксидом фосфору (переважно складні діефіри), наприклад продукти реакції між лауриловим спиртом і тетрафосфорною кислотою, причому такі продукти додатково можуть бути етоксильованими), сульфосукцинамат, а також і парафінові або олефінові сульфонати, таурати і лігносульфонати.

До прийнятних ПАР амфотерного типу належать бетаїни, пропіонати і гліцинати.

До прийнятних ПАР неіоногенного типу належать продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид або їх суміші, з жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол), неповні складні ефіри, які є похідними жирних кислот з довгим ланцюгом або ангідридів гекситу, продукти конденсації вказаних неповних складних ефірів з етиленоксидом, блокспівполімери (які містять етиленоксид і пропіленоксид), алканоламіди, просто складні ефіри (наприклад ефіри поліетиленгліколю і жирних кислот), оксиди амінів (наприклад оксид лаурилдиметиламіну) і лецитини.

Як відповідні суспендувальні агенти можуть використовуватися гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або натрійкарбоксиметилцелюлоза) і глини, які набухають, (такі як бентоніт або аттапульгіт).

Обробку сполукою формули (I) можна проводити будь-яким відомим методом застосування пестицидних сполук. Так, наприклад, сполукою формули (I) як такою або в складі препаративної форми, яка її містить, можна безпосередньо або розпиленням, обпиленням, нанесенням шляхом занурення, нанесенням у вигляді мазі, мастики або паст, впливом у вигляді пари або внесенням шляхом розкидання або шляхом закладання композиції, яка її містить, (такої як гранульована композиція або композиція, упакована в розчинний у воді мішок) у ґрунт або у водне середовище обробляти шкідників або місце їх заселення (зокрема місце скупчення або середовище заселення або шкідників культивовану рослину, піддану зараженню шкідниками) або ж будь-яку частину рослини, включаючи листи, стебла, гілки або корені, насіння до їх посіву або будь-які інші субстрати для вирощування або висаджування рослин (зокрема ґрунт, який оточує корені рослин, ґрунт у цілому, воду на затоплених рисових полях або системи для гідропонного культивування).

Сполука формули (I) можна також ін'єкувати у рослини або розпилювати або розприскувати на рослинність з використанням методів електродинамічного розпилення або інших методів малооб'ємного обприскування або вносити за допомогою наземних або повітряних систем зрошення.

Композиції, призначені для застосування у вигляді водних препаратів (водних розчинів або дисперсій), звичайно випускають у вигляді

концентратів з високим вмістом діючої речовини, яку перед застосуванням необхідно розбавляти водою. Одним з основних вимог, які часто пред'являються до подібних концентратів, які можуть являти собою дисперговані концентрати, суспензійні концентрати, емульгуювальні концентрати, емульсії типу "масло у воді", мікроемульсії, водорозчинні гранули, розчинні порошки, змочувані порошки, вододисперговані гранули і капсульовані суспензії, є стабільність при зберіганні протягом тривалого періоду часу, а після зберігання - здатність утворювати при розведенні водою водні препарати, які повинні залишатися гомогенними протягом достатнього проміжку часу для можливості їх внесення за допомогою звичайного розпилювального устаткування. Такі водні препарати залежно від конкретної мети їх застосування можуть містити сполуку формули (I) у кількостях, які змінюються в широких межах, (наприклад від 0,0001 до 10мас.%).

Сполуку формули (I) можна використовувати в суміші з добривами (наприклад азот-, калій- або фосфорвмісними добривами). До придатних для застосування в цих випадках типам препаративних форм належать гранульовані добрива. Вміст сполуки формули (I) у таких сумішах може досягати 25мас.%.

Відповідно до цього у винаході пропонується також композиція, яка містить добриво і сполуку формули (I).

Запропоновані у винаході композиції можуть також містити інші біологічно активні сполуки, наприклад живильні мікроелементи або сполуки, які мають фунгіцидну активність або регулюючу ріст рослин, гербіцидну, інсектицидну, нематоцидну або акарицидну активність.

Сполука формули (I) може бути єдиною діючою речовиною або композиції ж при необхідності може входити в її склад в суміші з однією або декількома додатковими діючими речовинами, такими як пестицид, фунгіцид, синергіст, гербіцид або регулятор росту рослин. Така додаткова діюча речовина може розширювати спектр дії композиції або підвищувати її стійкість до зовнішніх впливів до місцевої обробки, взаємно підсилювати дію або доповнювати дію сполуки формули (I) (наприклад прискорювати настання дії або усувати відлякуючу дію) або сприяти подоланню або запобіганню розвитку резистентності до індивідуальних діючих речовин. Вибір конкретної додаткової діючої речовини залежить від передбаченого призначення композиції. Як приклад придатних для застосування в цих цілях пестицидів можна назвати наступні:

а) піретроїди, такі як перметрин, циперметрин, фенвалерат, есфенвалерат, дельтаметрин, цигалотрин (зокрема лямбда-цигалотрин), біфентрин, фенпропатрин, цифлутрин, терфлутрин, безпечні для риб піретроїди (наприклад етофенпрокс), природний піретрин, тетраметрин, s-біоалетрин, фенфлутрин, пралетрин або 5-бензил-3-фурилметил-(E)-(1R,3S)-2,2-диметил-3-(2-оксотіолан-3-іліденметил)циклопропанкарбоксилат,

б) органофосфати, такі як профенофос, сулпрофос, ацефат, паратіон-метил, азинфос-метил, деметон-S-метил, гептенофос, тіометон, фенаміфос, монокротофос, триазофос, метамідофос, диметоат, фосфамідон, малатіон, хлорпірифос, фозалон, тербуфос, фенсульфотіон, фонофос, форат, фоксим, піриміфос-метил, піриміфос-етил, фенітротіон, фостіазат або діазинон,

в) карбамати (включаючи арилкарбамати), такі як прімікарб, тіазамат, хлоетокарб, карбофуран, фураціокарб, етіофенкарб, альдикарб, тіофурокс, карбосульфат, бендіокарб, фенобукарб, пропоксур, метоміл або оксаміл,

г) бензоїлсечовини, такі як дифлубензурон, трифлумурон, гексафлумурон, флуфеноксурон або хлорфлуазурон,

д) оловоорганічні сполуки, такі як цигексатин, фенбутиноксид або азоциклотин,

е) піразоли, такі як тебуфенпірад або фенпіроксимат,

є) макроліди, такі як авермектини або мілбемицини, наприклад абамектин, емабектинбензоат, івермектин, мілбемицин, спіносад або азадирахтин,

ж) гормони або феромони,

з) хлорорганічні сполуки, такі як ендосульфат, бензолгексахлорид, ДДТ, хлордан або діелдрин,

и) амідини, такі як хлордимеформ або амитраз,

і) фуміганти, такі як хлорпікрин, дихлорпропан, метилбромід або метам,

ї) хлорнікотинільні сполуки, такі як імідаклопрід, тіаклопрід, ацетаміпірид, нітенпірам або тіаметоксам,

й) діацилгідразини, такі як тебуфенозид, хромафенозид або метоксифенозид,

к) дифенілові ефіри, такі як діфенолан або пірипроксифен,

л) індоксакарб,

м) хлорфенапір або

н) піметрозин.

На додаток до перерахованих вище основних хімічних класів пестицидів у складі композиції з урахуванням кінцевої мети її застосування при необхідності можна використовувати й інші пестициди із спрямованою проти конкретних шкідників дією. Так, наприклад, у складі композиції, призначеної для застосування на конкретних сільськогосподарських культурах, можуть використовуватися селективні інсектициди і, зокрема, для застосування на рисі можуть використовуватися ефективні проти свердлильників або точильників інсектициди (такі як картап) або ефективні проти товстоногів інсектициди (такі як бупрофезин). В іншому варіанті до складу композицій можна також включати інсектициди або акарициди із спрямованою проти комах конкретних видів або стадій їх розвитку дією (наприклад акарицидні овіциди/ларвіциди, такі як клофентезин, флубензімін, гекситіазокс або тетрадіфон, акарицидні мотиліциди, такі як дикофол або пропаргіт, акарициди, такі як бромпропілат або хлорбензилат, або регулятори росту, такі як

гідраметилнон, циромазин, метопрен, хлорфлуазурон або дифлубензурон).

Як приклад сполук, які мають фунгіцидну дію, які можна включати до складу запропонованої у винаході композиції, можна назвати (Е)-N-метил-2-[2-(2,5-диметилфеноксиметил)феніл]-2-метоксиіміноацетамід (SSF-129), 4-бром-2-ціано-N,N-диметил-6-трифторметилбензимидазол-1-сульфонамід, α -[N-(3-хлор-2,6-ксиліл)-2-метоксиацетамідо]- γ -бутиролактон, 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-п-полілімідазол-1-сульфонамід (IKF-916, ціамідазосульфамід), 3,5-дихлор-N-(3-хлор-1-етил-1-метил-2-оксопропіл)-4-метилбензамід (RH-7281, зоксамід), N-аліл-4,5-диметил-2-триметилсилілтїофен-3-карбоксамід (MON 65500), N-(1-ціано-1,2-диметилпропіл)-2-(2,4-дихлорфенокси) пропіонамід (AC 382042), N-(2-метокси-5-піридил)циклопропанкарбоксамід, ацибензолар (CGA 245704), аланікарб, альдиморф, анілазин, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноміл, білоксазол, бітертанол, бластицидин S, бромуконазол, бупіримат, каптафол, каптан, карбендазим, карбендазим-хлоргідрат, карбоксин, карпропамід, карвон, CGA 41396, CGA 41397, хінометіонат, хлорталоніл, хлорзолінат, клозилаконт, мідьвмісні сполуки, такі як хлороксид міді, оксихінолят міді, сульфат міді, таллат міді і бордоська рідина, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дебакарб, 1,1'-діоксид ди-2-піридилдисульфід, дихлофлуанід, дикломезин, диклоран, дістофенкарб, дифенокконазол, дифензокват, дифлуметорим, О,О-діізопропіл-S-бензилтіофосфат, димефлуазол, диметконазол, диметоморф, диметиримол, диніконазол, динокап, дитіанон, додецилдиметиламоніхлорид, додеморф, додин, догуадін, едифенфос, епоксиконазол, етиримол, етил-(Z)-N-бензил-N([метил(метилтіоетилиденамінооксикарбоніл)аміно]тіо)- β -аланінат, етридіазол, фамоксадон, фенамідон (RPA 407213), фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід (KBR2738), фенпиклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентин-ацетат, фентин-гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуметовер, фторимід, флухікконазол, флусилазол, флутоланіл, флутриафол, фолпет, фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гуазатин, гексаконазол, гідроксізоксазол, гімексазол, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадин-триацетат, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб (SZX 0722), ізопропанілбутилкарбамат, ізопротіолан, касугаміцин, крезоксим-метил, LY 186054, LY 211795, LY 248908, манкозеп, манеб, мефеноксам, мепаніпірим, мепроніл, металаксил, метконазол, метирам, метирам-комплекс, метоміностробін, міклобутаніл, неоазоцин, диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуаримол, офурас, ртутьорганічні сполуки, оксаксидил, оксасульфурон, оксолінова кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, феназин-оксид, фосетил-алюміній, фосфорні кислоти, фталид, пікоксистробін (ZA 1963), поліоксин D, полірам, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамоккарб,

пропіконазол, пропінеб, пропіонова кислота, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, піроксифур, піролінтрин, солі четвертинного амонію, хінометіонат, хіноксифен, квінтоцен, сипконазол (F-155), пентахлорфенат натрію, спіроксамін, стрептоміцин, сірку, тебуконазол, теклофталам, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, 2-(тіоціанометилтіо)бензотіазол, тіофанат-метил, тирам, тимібенконазол, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименон, триазбутил, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін (CGA 279202), трифорин, трифлумізол, тритиконазол, валідаміцин А, вапам, вінклозоніл, цинеб і зирам.

Сполуки формули (I) можна змішувати з ґрунтом, торфом або іншими субстратами для вирощування рослин з метою захисту рослин від мікозів, які передаються через насіння, через ґрунт або уражають листя.

Як приклад синергістів, які можуть використовуватися в складі композицій, можна назвати піперонілбутоксид, сезамекс, сафроксан і додецилімідазол.

Конкретний тип гербіцидів і регуляторів росту рослин, які включаються до складу композицій, залежить від конкретного шкідника, з яким передбачається проводити боротьбу, і від необхідного ефекту.

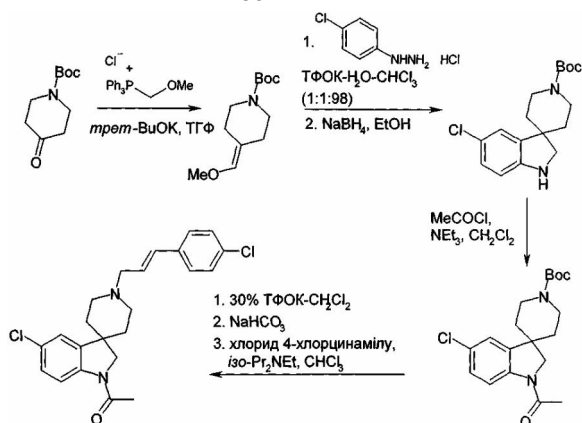
Прикладом селективного гербіциду для застосування на рисі, що (гербіцид) можна включати до складу запропонованої у винаході композиції, служить пропаніл. Прикладом регулятора росту рослин для застосування на бавовнику служить РІХTM.

Деякі суміші можуть містити діючі речовини, які значно відрізняються між собою за своїми фізичними, хімічними або біологічними властивостями і які тому не настільки просто об'єднати в складі однієї і тієї ж звичайної препаративної форми. У цих випадках можна одержувати препаративні форми інших типів. Так, наприклад, якщо одна діюча речовина являє собою не розчинну у воді тверду речовину, а інша - не змішувана з водою рідина, то кожну діючу речовину проте можна диспергувати в одній і тій же безперервній водній фазі, диспергуючи тверду діючу речовину за типом суспензії (з використанням методу, аналогічного до методу одержання суспензійного концентрату), а рідку діючу речовину - за типом емульсії (з використанням методу, аналогічного до методу одержання емульсії типу "масло у воді"). Одержувана в результаті композиція являє собою препаративну форму у вигляді суспо-емульсії.

Нижче винахід проілюстрований на прикладах.

Приклад 1

У цьому прикладі описане одержання сполуки V-22, яка представляє собою 1-ацетил-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання трет-бутилового ефіру 4-метоксиметилпеперидин-1-карбонової кислоти

До перемішаного розчину хлориду метоксиметилтрифенілфосфонію (65,3г) у безводному ТГФ (500мл) в атмосфері азоту при 4°C порціями додавали трет-бутоксид калію (21,3г). При цьому реакційна суміш набувала яскраво-жовтого забарвлення, і в такому вигляді реакційну суміш залишали на 1 год. Після цього повільно додавали трет-бутиловий ефір 4-оксопеперидин-1-карбонової кислоти 1 (25г), не даючи температурі підвищуватися вище 10°C, і потім суміші давали нагрітися до кімнатної температури протягом ночі. Далі реакційну суміш зливали у воду (150мл), тричі екстрагували етилацетатом (100мл) і об'єднані органічні фази промивали розсоллом (300мл), сушили над безводним сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням коричневого масла (50г). Після експрес-хроматографії [SiO₂, гексан, а потім суміш етилацетат/гексан (у співвідношенні 10:90)] одержали 26,4г (77%) цільового простого енольного ефіру.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,5 (9H, m), 2,0-2,2 (m, 4H), 3,4 (m, 4H), 3,5 (s, 3H), 5,9 (s, 1H).

МС (ES+): 228 (M+H⁺), 172 (M-ізобутен+H⁺).

Стадія 2: Одержання трет-бутилового ефіру 5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти

До перемішаного розчину трет-бутилового ефіру 4-метоксиметилпеперидин-1-карбонової кислоти (12,5г), гідрохлориду 4-хлорфенілгідрозина (9,75г) і етанолу (1мл) у хлороформі (1200мл) при 4°C в атмосфері азоту додавали трифтороцтову кислоту (12мл). Після цього суміш протягом ночі перемішували при 50°C, у ході чого вона набувала темно-зеленого забарвлення. Реакцію припиняли додаванням концентрованого розчину аміаку (200мл) у суміші води з льодом (500мл), у результаті чого органічний шар набував жовтого забарвлення. Органічний шар відокремлювали, а водний шар додатково двічі екстрагували дихлорметаном. Об'єднані органічні фази промивали розсоллом (300мл), сушили над безводним сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням 13г сирого іміну - трет-бутилового ефіру 5-хлорспіро[3H-індол-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (з чистотою приблизно 80% за даними ЯМР-аналізу).

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,5 (9H, m), 1,70 (m, 2H), 1,85 (m, 2H), 3,50 (m, 2H), 4,05 (m, 2H), 7,35 (m, 2H), 7,60 (s, 1H), 8,35 (s, 1H).

МС (ES+) 321/323 (M+H⁺), 265/267 (M-ізобутен+H⁺), 221/223 (M-Boc+H⁺).

До перемішаного розчину сирого іміну (12г) в абсолютному етанолі (500мл) в атмосфері азоту додавали боргидрид натрію (6,0г). Далі реакційну суміш перемішували протягом 15хв і залишали стояти протягом ночі. Потім суміш концентрували у вакуумі і залишок повторно розчиняли в дихлорметані (100мл). Органічні фази промивали водою (100мл) і розсоллом (100мл), сушили над безводним сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням коричневої твердої речовини. Після експрес-хроматографії [SiO₂, етилацетат/гексан/триетиламін (у співвідношенні 25:75:1)] одержали 9,8г (56%, сумарно по обох стадіях) цільового індоліну

*t*_{пл} 165-166°C.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,5 (9H, s), 1,70 (m, 4H), 2,9 (m, 2H), 3,50 (s, 2H), 3,75 (ушир, s, 1H), 4,05 (m, 2H), 6,55 (d, J=6Гц, 1H), 7,00 (m, 2H).

МС (ES+) 323/325 (M+H⁺), 267/269 (M-ізобутен+H⁺), 223/225 (M-Boc+H⁺).

Стадія 3: Одержання трет-бутилового ефіру 1-ацетил-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти

До перемішаного розчину трет-бутилового ефіру 5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (9,8г) і триетиламіну (15мл) у безводному дихлорметані (400мл) в атмосфері азоту по краплях додавали ацетилхлорид (2,8мл). Потім реакційну суміш перемішували протягом 1 год, після чого реакцію припиняли додаванням насиченого розчину бікарбонату натрію (200мл). Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням 9,8г (87%) цільового аміду у вигляді білуватої твердої речовини.

*t*_{пл} 64-66°C.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): суміш ротамерів у співвідношенні 6:1: основний ротамер: 1,5 (9H, s), 1,70 (m, 2H), 1,85 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,85 (m, 2H), 3,90 (s, 2H), 4,2 (m, 2H), 6,97 (d, J=1Гц, 1H), 7,20 (dd, J=7 і 1Гц, 1H), 8,15 (d, J=7Гц, 1H); другорядний ротамер: 1,5 (9H, s), 1,70 (m, 2H), 1,85 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,85 (m, 2H), 4,05 (s, 2H), 4,2 (m, 2H), 7,2 (d, J=1Гц, 1H), 7,25 (dd, J=7 і 1Гц, 1H), 7,48 (d, J=7Гц, 1H).

Стадія 4: Одержання 1-ацетил-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину]

До перемішаного розчину трет-бутилового ефіру 1-ацетил-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (8г) у безводному дихлорметані (250мл) в атмосфері азоту додавали трифтороцтову кислоту (25мл). Реакційну суміш залишали в такому вигляді на 3 год. Після цього реакційну суміш промивали насиченим розчином бікарбонату (200мл), сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням білуватої твердої речовини. Після експрес-хроматографії [SiO₂, суміш метанол/дихлорметан/триетиламін (у співвідношенні 90:5:5)] одержали 5,6г (61%)

цільового 1-ацетил-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину].

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): суміш ротамерів у співвідношенні 6:1: основний ротамер: 1,70 (m, 2H), 1,80 (m, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,75 (t, J=12Гц, 2H), 3,15 (m, 2H), 3,90 (s, 2H), 7,12 (d, J=1Гц, 1H), 7,18 (dd, J=7 і 1Гц, 1H), 8,15 (d, J=7Гц, 1H); другорядний ротамер (вибіркові дані): 2,44 (s, 3H), 2,86 (m, 2H), 3,10 (m, 2H), 4,05 (s, 2H).

МС (ES⁺) 265/267 (M+H⁺).

Стадія 5: Одержання 1-ацетил-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

До перемішуваної суміші 1-ацетил-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину] (5,3г) і діізопропілетиламіну (6,7мл) у хлороформі (120мл) в атмосфері азоту при кімнатній температурі повільно додавали розчин хлориду 4-хлорцинамилу (4,0г) у хлороформі (120мл). Потім реакційну суміш нагрівали до 50°C і витримували при цій температурі протягом 30год. Після цього реакційну суміш концентрували у вакуумі з одержанням червоного масла. Після експрес-хроматографії [SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін (у співвідношенні 50:50:1)] одержали 5,1г (68%) цільової сполуки.

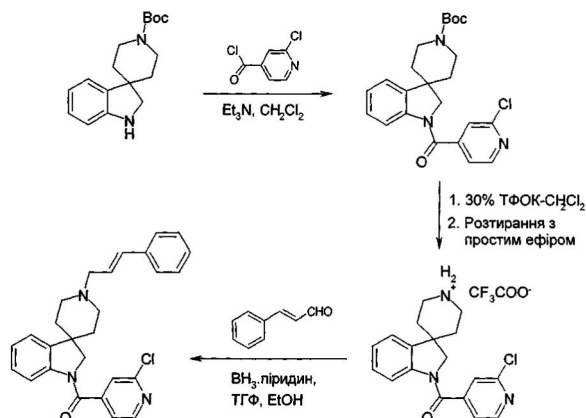
¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): суміш ротамерів у співвідношенні 5:1: основний ротамер: 1,70 (d, J=12Гц, 2H), 2,0 (td, J=12 і 2Гц, 2,08 (t, J=12Гц, 2H), 2,25 (s, 3H), 3,03 (d, J=12Гц, 2H), 3,20 (d, J=7Гц, 2H), 3,96 (s, 2H), 6,28 (dt, J=12 і 5Гц, 1H), 6,50 (d, J=12Гц, 1H), 7,13 (d, J=1Гц, 1H), 7,18 (dd, J=7 і 1Гц, 1H), 7,3 (m, 4H), 8,15 (d, J=7Гц, 1H); другорядний ротамер (вибіркові дані): 2,42 (s, 3H), 4,00 (s, 2H).

МС (ES⁺) 415/417/419 (M+H⁺).

Аналогічно до прикладу 1 одержували сполуки II-301, V-21, XXIX-49, V-192, V-62, V-202 XXX-1, XXX-11, XXX-1-1, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXX-14, XXX-15, XXX-16, XXX-17, XXX-18, XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-21, XXX-22, XXX-23, XXX-24, XXX-25, XXX-26, XXX-27, XXX-28, XXX-29, XXX-3, XXX-4, XXX-5, XXX-6, XXX-7, XXXII-7, XXX-8, XXXI-2, XXXI-8, XXXII-1, XXXII-10, XXXII-2, XXXII-3, XXXII-4, XXXII-5, XXXII-6, XXXII-8 і XXXII-9.

Приклад 2

У цьому прикладі описане одержання сполуки I-1, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-фенілаіл]спіро[індолін-3,4'-піперидину].



трет-Бутиловий ефір спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти одержували аналогічно до стадій 1 і 2 прикладу 1.

Стадія 1: трет-Бутиловий ефір 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти

До 2-хлорізонікотинової кислоти (1,2г) при кімнатній температурі додавали тіонілхлорид (20мл). Далі додавали ДМФ (2 краплі) і суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом 1год. Надлишок тіонілхлориду випарювали і залишок розчиняли в дихлорметані (50мл). Далі додавали триетиламін (2мл), а потім по краплях додавали розчин трет-бутилового ефіру спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (1,7г) у дихлорметані (20мл). Після цього суміш перемішували протягом 48год. Потім реакційну суміш промивали буферним розчином з pH 9,4 (100мл) і водний шар екстрагували дихлорметаном. Об'єднані органічні шари сушили (сульфат магнію), фільтрували й упарювали. Сирий продукт очищали хроматографією [SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін у співвідношенні 50:50:1 зі збільшенням полярності до співвідношення 100:0:1] з одержанням 2,4г (94%) цільового аміду.

*t*_{пл} 212°C.

¹H-ЯМР (400МГц, ¹H-ЯМР): 1,50 (s, 9H), 1,6-1,8 (m, 4H), 2,8 (ушир, s, 2H), 3,9 (ушир, s, 2H), 4,08 (d, 2H), 7,0-7,2 (m, 3H), 7,30 (d, J=6Гц, 1H), 8,43 (d, J=6Гц, 1H), 7,40 (s, 1H), 8,0-8,2 (ушир, m, 1H).

МС (ES⁺) 428/430 (M+H⁺), 372/374 (M+H⁺-ізобуген).

Стадія 2: Одержання трифторацетатної солі 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидину]

До розчину трет-бутилового ефіру 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (2,3г) у безводному дихлорметані (50мл) додавали трифтороцтову кислоту (30мл), що супроводжувалося потемнінням розчину. Реакційну суміш залишали в такому вигляді на 15хв. Потім реакційну суміш упарювали у вакуумі і темний залишок ресуспендували в сухому простому ефірі (100мл). Залишок розтирали до утворення вільноплинного бежевого осаду. Цей осад збирали фільтрацією і сушили в потоці азоту з одержанням 2,28г (96%) цільової солі аміну.

*t*_{пл} 245°C (розкладання).

¹H-ЯМР (400МГц, d₆-DMCO): 1,8 (m, 2H), 1,9 (m, 2H), 2,9 (m, 2H), 3,25 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 7,15-7,3 (m, 2H), 7,24 (d, J=8Гц, 1H), 7,56 (d, J=7Гц, 1H), 7,62 (s, 1H), 8,1 (ушир, s, 1H), 8,56 (d, J=7Гц, 1H), 8,8 (ушир, s, 2H).

МС (ES⁺) 328/330 (M+H⁺).

Стадія 3: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-фенілаіл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

Трифторацетатну сіль 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,44г) і транс-цинамальдегід (0,29г) суспендували в тетрагідрофурані (8мл) і етанолі (6мл). Після цього додавали боран-піридиновий комплекс (0,26мл) і реакційну суміш інтенсивно перемішували

протягом ночі при кімнатній температурі. Далі суміш упарювали і розподіляли між дихлорметаном і водою. Органічні фази сушили над безводним сульфатом магнію й упарювали у вакуумі. Після експрес-хроматографії [SiO_2 , суміш етилацетат/гексан/триетиламін у співвідношенні 25:75:1 зі збільшенням полярності до співвідношення 50:50:1] одержали 0,42г (94%) цільового продукту.

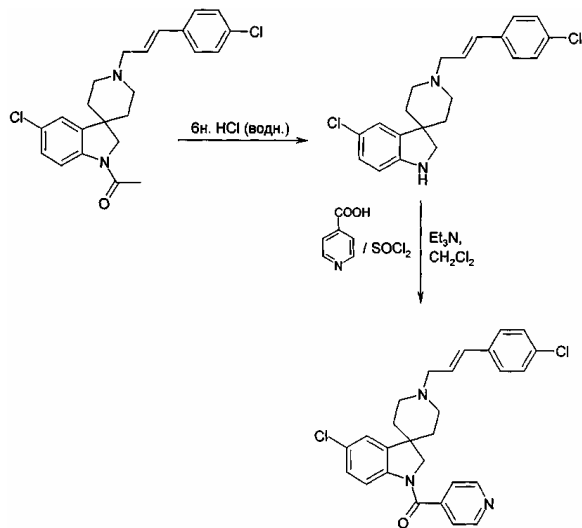
^1H -ЯМР (400МГц, CDCl_3): суміш ротамерів у співвідношенні 3:1: основний ротамер: 1,70 (m, 2H), 1,8-2,1 (m, 4H), 3,0 (m, 2H), 3,20 (m, 2H), 3,75 (m, 2H), 6,3 (m, 1H), 6,52 (d, $J=12\text{Гц}$, 1H), 7,1-7,4 (m, 9H), 7,46 (d, $J=2\text{Гц}$, 1H), 8,2 (ушир, m, 1H), 8,6 (m, 1H).

МС (ES+) 444/446 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Аналогічно до прикладу 2 одержували сполуки I-5, I-4, XXIX-7, XXIX-13, I-182, I-142, I-132, XXII-22, VI-1, VI-101, I-22, XXX-96, XXIX-31 (з алкілюванням на останній стадії), XXIX-37 (з алкілюванням на останній стадії), XXIX-43 (з алкілюванням на останній стадії), XXVII-1 (з наступною обробкою HCl у простому ефірі), XXVII-2 (з наступною обробкою HCl у простому ефірі), XXVII-22 (с наступною обробкою HCl у простому ефірі), XXVI-1 (з наступною обробкою пероксидом водню в метанолі) і XXIX-25 (з ацилюванням на останній стадії).

Приклад 3

У цьому прикладі описане одержання сполуки VI-22, яка представляє собою 1-(піридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



1-ацетил-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] одержували за методами, описаними у прикладі 1.

Стадія 1: Одержання 5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфетл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

1-ацетил-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] (5,0г) розчиняли в 6N. соляній кислоті (100мл) і нагрівали зі зворотним холодильником протягом 3год. Далі суміш охолоджували, водний шар підлогували до pH 12 твердим гранульованим NaOH (при виконанні цієї операції слід дотримуватися

обережності, оскільки цей процес носить екзотермічний характер) і додавали триетиламін (20мл). Потім суміш тричі екстрагували хлороформом. Після цього органічні шари сушили над безводним сульфатом натрію, фільтрували й упарювали у вакуумі з одержанням сирого коричневого масла, яке очищали колонковою хроматографією (SiO_2 , суміш етилацетат/гексан/триетиламін у співвідношенні 1:1:0,01) з одержанням 3,94г (88%) цільового індоліну.

МС (ES+) 373/375/377 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Стадія 2: Одержання 1-(піридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

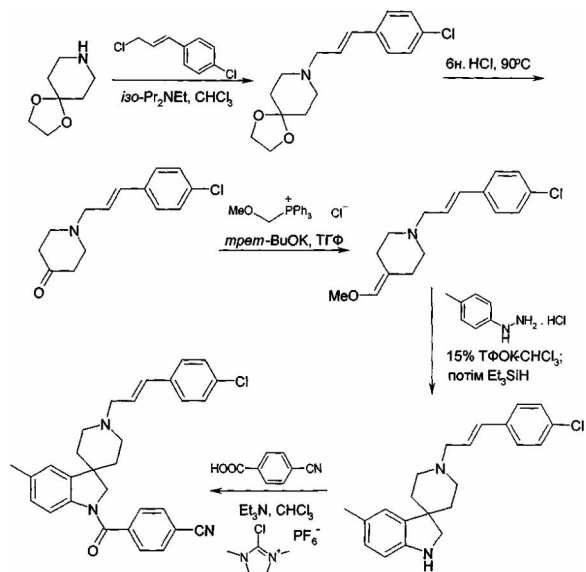
У тіонілхлориді (2мл) розчиняли ізонікотинову кислоту (0,022г) і ДМФ (1 крапля) і суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом 1год. Після цього суміш давали охолонути і надлишок тіонілхлориду випарювали у вакуумі. Залишок розчиняли в хлороформі (4мл) і додавали триетиламін (0,1мл). Після цього додавали розчин 5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,055г) у хлороформі (1мл) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 18год. Далі додавали водний розчин карбонату натрію (1-молярний, 20мл) і суміш екстрагували хлороформом (3x20мл). Об'єднані органічні шари сушили (сульфат магнію), фільтрували й упарювали у вакуумі з одержанням сирого коричневого масла, яке очищали хроматографією (SiO_2 , суміш етилацетат/гексан/триетиламін у співвідношенні, що змінюється від 0:1:0,01 до 1:0:0,01) з одержанням 0,034г (49%) цільового аміду.

МС (ES+) 478/480/482 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Аналогічно до прикладу 3 одержували сполуки XXV-62, I-192, I-202, XXIX-189, VI-202 і VI-62.

Приклад 4

У цьому прикладі описане одержання сполуки XIX-202, яка представляє собою 1-(4-ціанобензоїл)-5-метил-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання 8-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]-1,4-діокса-8-азаспіро[4.5] декану

1,4-діокса-8-азаспіро[4.5]декан (0,88г) розчиняли в хлороформі (5мл) і додавали діізопропілетиламін (2,1мл). Далі додавали розчин хлориду 4-хлорцинамилу (1,2г) у хлороформі (2мл), суміш нагрівали до 70°C і витримували при цій температурі протягом ночі. Потім розчинники випарювали у вакуумі і після експрес-хроматографії [SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін (у співвідношенні 50:50:2)] одержали 1,38г (76%) цільового кеталу у вигляді жовтого масла.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,78 (t, J=4Гц, 4H), 2,60 (ушир, s, 4H), 3,18 (d, J=5Гц, 2H), 3,96 (s, 4H), 6,27 (dt, J=12 і 5Гц, 1H) 6,47 (d, J=12Гц, 2H), 7,28, (m, 4H).

МС (ES+) 294/296 М+Н⁺.

Стадія 2: Одержання 1-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]-4-оксопіперидину

8-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]-1,4-діокса-8-азаспіро[4.5]декан (1,38г) розчиняли в метанолі (40мл) і додавали 6н. соляну кислоту (120мл). Потім суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом 4год. Після цього суміш охолоджували і підлугували до рН 14 твердим гранульованим гідроксидом натрію (при виконанні цієї операції слід дотримуватися обережності, оскільки цей процес носить екзотермічний характер), у ході чого розчин ставав непрозорим. Водну фазу тричі екстрагували простим ефіром. Органічні фази промивали розсоллом, сушили над безводним MgSO₄ і упарювали з одержанням 1,17г (100%) цільового кетону.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 2,38 (m, 4H), 2,70 (m, 4H), 3,15 (d, J=5Гц, 2H), 3,96 (s, 4H), 6,17 (dt, J=12 і 5Гц, 1H), 6,40 (d, J=12Гц, 1H), 7,20 (m, 4H).

МС (ES+) 250/252 М+Н⁺.

Стадія 3: Одержання 1-[транс-3-(4-хлорфетл)аліл]-4-метоксиметилепіперидину

Хлорид метоксиметилтрифенілфосфонію (2,4г) розчиняли в тетрагідрофурані (20мл) і охолоджували до 4°C. Потім додавали трет-бутоксид калію (0,78г), у результаті чого розчин набував світло-жовтогарячого забарвлення. Реакційну суміш залишали в такому вигляді на 30хв. Далі додавали розчин 1-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]-4-оксопіперидину (0,85г) у тетрагідрофурані (10мл) і суміш перемішували протягом 10хв. Після цього розчинники випарювали у вакуумі і залишок ресуспендували в простому ефірі. Органічні фази промивали водою і сушили над безводним сульфатом магнію. Після експрес-хроматографії [SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін (у співвідношенні 50:50:2)] одержали 0,85г (89%) цільового енольного ефіру.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 2,10 (t, J=6Гц, 2H), 2,35 (t, J=6Гц, 2H), 2,4 (m, 4H), 3,13 (d, J=5Гц, 2H), 3,55 (s, 3H), 5,80 (s, 1H), 6,30 (dt, J=11 і 5Гц, 1H), 6,45 (d, J=11Гц, 1H), 7,28 (m, 4H).

МС (ES+) 278/280 (М+Н⁺).

Стадія 4: Одержання 5-метил-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

До перемішаного розчину 1-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]-4-метоксиметилепіперидину і

гідрохлориду 4-толілгідазину (28мг) у хлороформі (5мл) додавали трифтороцтову кислоту (0,75мл), реакційну суміш нагрівали до 50°C і витримували при цій температурі протягом 5год. Далі додавали триетилсилан (2мл) і реакційну суміш витримували при 50°C ще протягом наступних 5год. Потім суміші давали охолонути і реакцію припиняли зливанням реакційної суміші в суміш з концентрованого розчину аміаку і льодяної крихти (20мл). Водну фазу двічі екстрагували хлороформом, об'єднані органічні фази сушили над безводним сульфатом магнію і концентрували у вакуумі з одержанням 0,04г (63%) цільового індоліну.

¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,75 (d, J=9Гц, 2H), 1,96 (td, J=8 і 2, 2H), 2,13 (t, J=9Гц, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,95 (d, J=10Гц, 2H), 3,19 (d, J=5Гц, 2H), 3,42 (s, 2H), 6,30 (dt, J=11 і 5Гц, 1H), 6,48 (d, J=11Гц, 1H), 6,58 (d, J=7Гц, 1H), 6,85 (d, J=7Гц, 1H), 6,9 (s, 1H), 7,30 (m, 4H).

МС (ES+) 353/355 (М+Н⁺), 203 (М-хлорцинамил+Н⁺).

Стадія 5: Одержання 1-(4-ціанобензоїл)-5-метил-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

Для проведення цієї стадії використовували робот для хімічного синтезу Zymark XP2. В одну пробірку робота заливали розчин 5-метил-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (2мл розчину, отриманого розчиненням 1,43г вказаної речовини в 100мл ТГФ) і розчинник видаляли у вакуумі. В іншу пробірку робота відмірювали 4-ціанобензойну кислоту (28мг). До цієї кислоти додавали розчин гексафторфосфату 2-хлор-1,3-диметил-2-імідазолінію (2мл розчину, отриманого розчиненням 4,80г вказаної речовини в 180мл хлороформу) і розчин триетиламіну (2мл розчину, отриманого розчиненням 8,68мл вказаної речовини в 250мл хлороформу), після чого вміст пробірки перемішували і залишали стояти на 30хв. Потім у пробірку із сухим аміном в аликвотній кількості, що дорівнює 2мл, додавали кислий розчин. Вміст цієї пробірки перемішували і залишали стояти протягом ночі. Після цього реакційну суміш промивали 1-молярним водним розчином карбонату натрію і випарювали розчинники. Сирі суміш очищали шляхом рідинної хроматографії під контролем МС з одержанням цільового аміду в кількості 2,9мг.

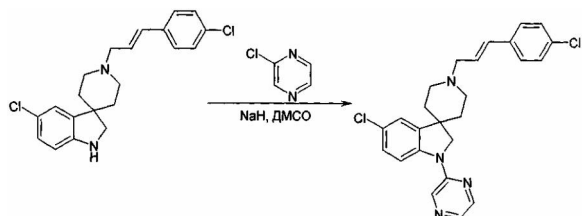
МС (ES+) 482/484 (М+Н⁺).

Аналогічно до прикладу 4 одержували сполуки I-61, I-171, XXVIII-97, XIX-22, XXVIII-67, XXVIII-7, XX-22, XXIX-69, XXIX-75, XVIII-22, XXVIII-217, XXIX-81, XXIX-87, XV-22, XXIX-93, XXIX-99, XXVIII-187, XXI-22, XXIX-105, XXIX-111, XXIX-117, XXIX-123, XIII-22, XXIX-129, X-22, XXIX-135, XXIX-141, XXIX-147, XXIX-153, XII-22, XXIX-196, II-22, XXIX-159, XXVIII-252, XXVIII-27, XXVIII-42, XVIII-202, XX-62, XXIX-165, XXVIII-162, XXVIII-132, XXIX-171, XXIX-177, XXI-62, XVII-62, XIII-62, X-62, XXIX-183, XI-62, IX-62, XXIX-207, XXIX-195, II-62, I-92, I-112, I-12, I-32, I-52, I-72, I-152, I-162, I-82, I-252, I-242, I-262, I-292, I-62 XXX-10, XXX-116, XXX-117, XXX-30, XXX-33, XXX-34, XXX-35, XXX-36, XXX-37, XXX-38, XXX-39, XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-43, XXX-44,

XXX-45, XXX-46, XXX-47, XXX-48, XXX-49, XXX-50, XXX-9 і XXX-93.

Приклад 5

У цьому прикладі описане одержання сполуки XIV-22, яка представляє собою 1-(2-піразиніл)-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] одержували аналогічно до прикладу 3.

До перемішаного розчину 5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (35мг) і 2-хлорпіразину (43мг) у безводному ДМСО (5мл) в атмосфері азоту додавали гідрид натрію (50мг). Далі реакційну суміш нагрівали до 60°C і витримували при цій температурі протягом ночі. Потім реакційну суміш розбавляли розсолем (20мл) і чотири рази екстрагували дихлорметаном (20мл). Об'єднані органічні фази сушили над сульфатом магнію і концентрували у вакуумі (1мм рт.ст.) з одержанням коричневого масла. Після експрес-хроматографії [SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін із градієнтом співвідношення, що змінюється від 0:98:2 до 98:0:2] одержали 25мг (55%) цільового продукту.

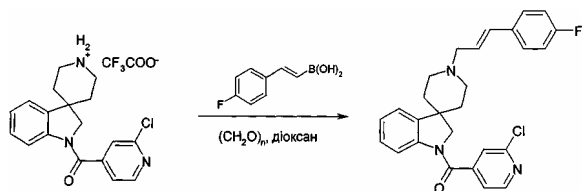
¹H-ЯМР (400МГц, CDCl₃): 1,75 (m, 2H), 2,05 (td, J=8 і 2, 2H), 2,18 (t, J=9Гц, 2H), 3,05 (d, J=9Гц, 2H), 3,22 (d, J=5Гц, 2H), 3,94 (s, 2H), 6,30 (dt, J=11 і 5Гц, 1H), 6,51 (d, J=11Гц, 1H), 7,18 (m, 2H), 7,30 (m, 4H), 8,05 (d, J=1Гц, 1H), 8,17 (d, J=6Гц, 1H), 8,25 (m, 2H).

МС (ES+) 451/453/455 M+H⁺.

Аналогічно до прикладу 5 одержували сполуки XXIX-57 і XXIX-63.

Приклад 6

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXII-3, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-фторфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Трифторацетатну сіль 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидину] одержували аналогічно до прикладу 2.

Трифторацетатну сіль 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбонілспіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,25г) суспендували в діоксані (2мл) і додавали параформальдегід (0,08г). Суміш перемішували, нагрівали до 90°C і витримували при цій температурі протягом 20хв. У діоксані (2мл)

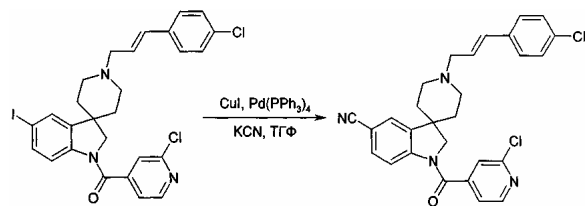
розчиняли 2-(4-фторфеніл)вінілборонову кислоту (0,10г), отриманий розчин додавали до суміші солі/параформальдегіду, отриману суміш нагрівали до 90°C і витримували при цій температурі протягом 24год. Потім суміші давали охолонути і досуха упарювали у вакуумі. Залишок розподіляли між дихлорметаном і водою, органічний шар промивали водним розчином карбонату натрію (1-молярним) і упарювали. Сирий продукт очищали колонковою хроматографією (SiO₂, елювання на першій колонці сумішшю дихлорметан/триетиламін у співвідношенні 95:5, після чого на другій колонці спочатку чистим дихлорметаном, а потім сумішшю етилацетат/гексан/триетиламін із градієнтом співвідношення, що змінюється від 25:75:1 до 95:0:5) з одержанням 0,20г (76%) цільового продукту.

МС (ES+) 462/464 M+H⁺.

Аналогічно до прикладу 6 одержували сполуки I-23, XXIX-1, I-21, I-2, XXVI-2 (з наступною обробкою пероксидом водню в метанолі) і XXVI-22 (з наступною обробкою пероксидом водню в метанолі).

Приклад 7

У цьому прикладі описане одержання сполуки I-212, яка представляє собою 5-ціано-1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



5-йод-1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] одержували аналогічно до прикладу 2.

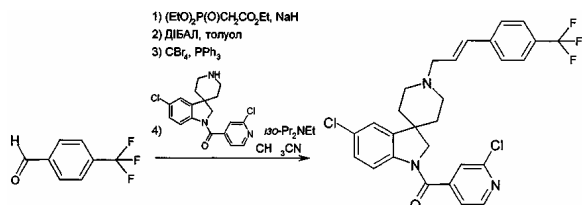
5-йод-1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] (0,05г) в атмосфері сухого азоту розчиняли в безводному ТГФ (5мл). Далі додавали ціанід калію (0,011г) і йодид міді(I) (0,016г) і суміш дегазували протягом 15хв. Після цього додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій (0,005г) і суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом 28год. Потім реакційну суміш розбавляли дихлорметаном (50мл) і промивали водою (30мл). Водний шар екстрагували дихлорметаном (2x40мл), після чого об'єднані органічні шари сушили (сульфат магнію), фільтрували й упарювали у вакуумі з одержанням безбарвного масла, яке очищали препаративною ТШХ (SiO₂, суміш EtOAc/гексан/Et₃N у співвідношенні 1:1:0,01) з одержанням 0,041г (95%) цільового продукту.

МС (ES+) 503/505/507 M+H⁺.

Стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 7, одержували сполуки XXIX-201, I-282, I-232. Обробкою сполуки XXIX-201 карбонатом калію в метанолі одержували сполуку XXV-222. Повторним ацилюванням сполуки XXV-222 у стандартних умовах одержували сполуку I-222.

Приклад 8

У цьому прикладі описане одержання сполуки ХХХ-51, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(E)-3-(4-трифторметилфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання етилового ефіру (E)-3-(4-трифторметилфеніл)акрилової кислоти

До суспензії гідриду натрію (55%-ного в маслі, 15г) у 1,2-диметоксетані (500мл) при кімнатній температурі по краплях додавали етилдитилфосфоацетат (84г) у 1,2-диметоксетані (100мл). Після цього додавали 4-трифторбензальдегід (43,5г), розчинений у 1,2-диметоксетані (100мл), і отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 4 год. Реакцію припиняли додаванням води (400мл), розбавляли діетиловим ефіром (700мл), органічні фази відокремлювали, промивали розсолем, сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі. Сирий продукт перекристалізовували з гексану з одержанням 37г цільового продукту (61%), який характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 2: Одержання (E)-3-(4-трифторметилфеніл)проп-2-ен-1-олу

До розчину складного ефіру, отриманого на стадії 1 (37,1г), у толуолі (310мл) при 0°C по краплях додавали діізобутиلالюмогідрид (1,2-молярний у толуолі, 317мл) і розчин перемішували при 0°C протягом 1 год. Далі при 0°C обережно додавали воду (47,6мл), потім 2-молярний гідроксид натрію (47,6мл) і на завершення воду (95,1мл). Після цього суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Після фільтрації розчин промивали 2н. соляною кислотою, водою і розсолем, сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням 29,5г цільового спирту у вигляді твердої речовини (96%), який характеризували її мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 3: Одержання 1-((E)-3-бромпропеніл)-4-трифторметилбензолу

До розчину спирту, отриманого на стадії 2 (10г), у диметилацетаміді (100мл) при кімнатній температурі додавали трифенілфосфін (23г) і чотирибромистий вуглець (29г). Отриманий розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год, зливали у воду й екстрагували етилацетатом. Органічну фазу промивали водою і розсолем, сушили над сульфатом натрію і фільтрували через силікагель з одержанням 13г цільового продукту у вигляді білої твердої речовини (95%), яку характеризували її мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 4: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(E)-3-(4-

трифторметилфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

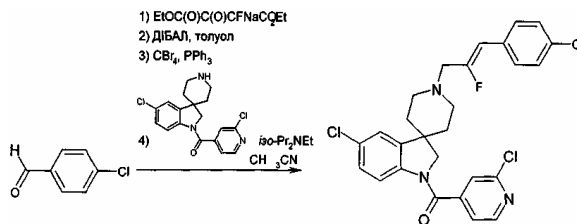
До перемішуваної суспензії 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину] (20г) і діізопропілетиламіну (18,2мл) в ацетонітрилі (200мл) додавали алілбромід, отриманий на стадії 3 (11,6г), і реакційну суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після цього розчин розбавляли етилацетатом (200мл), промивали розсолем (3x100мл), сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі. Залишок очищали колонковою хроматографією (SiO₂, суміш етилацетат/гексан/триетиламін у співвідношенні 95:5:0,1, а потім сумішшю етилацетат/метанол/триетиламін у співвідношенні 95:5:0,1) з одержанням 18,9 г цільового продукту (82%).

$t_{пл}$ 130°C.

Стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 8, одержували сполуки ХХХ-82, ХХХ-83, ХХХ-84, ХХХ-85, ХХХ-86, ХХХ-87, ХХХ-91 і ХХХ-92.

Приклад 9

У цьому прикладі описане одержання сполуки ХХХ-113, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-хлорфеніл)-2-фтораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання метилового ефіру (Z)-3-(4-хлорфеніл)-2-фторакрилової кислоти

Сполуку на цій стадії одержували аналогічно до методу, описаного в [J. Cousseau і ін., Tetrahedron Lett. 43, 1993, с.6903]:

До суспензії натрієвої солі діетилфтороксалиацетату (1г, отриманої з діетилоксалату, етилфторацетату і гідриду натрію відповідно до методу, описаного у [Alberg і ін., J. Am. Chem. Soc. 1992, с.3542]) у тетрагідрофурані (20мл) при 0°C додавали 4-хлорбензальдегід (0,66г) і отриману суміш перемішували протягом 1 год при 0°C, а потім протягом 3 год при 80°C. Після цього реакційну суміш концентрували у вакуумі, розбавляли діетиловим ефіром, промивали водним бікарбонатом натрію, водою і розсолем, сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі з одержанням сирого залишку (1,2г), який безпосередньо використовували на наступній стадії.

Стадія 2: Одержання (Z)-3-(4-хлорфеніл)-2-фторпроп-2-ен-1-ола

Стадія 3: Одержання 1-((Z)-3-бром-2-фторпропеніл)-4-хлорбензолу

Стадія 4: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-хлорфеніл)-2-фтораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

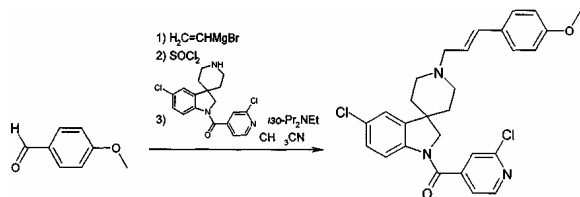
Стадії 2-4 проводили відповідно до стадій 2-4 прикладу 8 з одержанням 0,17г цільового продукту (41%), який характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

МС (ES+) 530.

Стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 9, одержували сполуку XXX-114.

Приклад 10

У цьому прикладі описане одержання I-25, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[транс-3-(4-метоксифеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання 1-(4-метоксифеніл)проп-2-ен-1-олу

До розчину п-анісового альдегіду (1,54мл) у тетрагідрофурані (20мл) в атмосфері аргону при -10°C по краплях додавали вінілмагнійбромід (1-молярний у ТГФ, 12,5мл). Отриманий розчин перемішували протягом ночі при кімнатній температурі і реакцію припиняли додаванням насиченого водного розчину хлориду амонію (20мл). Органічну фазу відокремлювали, сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі. Залишок очищали колонковою хроматографією (SiO₂, суміш етилацетат/циклогексан у співвідношенні 7:3) з одержанням 1,05г цільового продукту у вигляді безбарвного масла (51%), яке характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 2: Одержання 1-((E)-3-хлорпропеніл)-4-метоксибензолу

До розчину алілового спирту, отриманого на стадії 1 (200мг), у діетиловому ефірі (3мл) додавали тіонілхлорид (0,087мл) і розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 1год. Потім розчин концентрували у вакуумі з одержанням 221мг цільового продукту (100%) у вигляді безбарвної твердої речовини.

$t_{пл}$ 70°C.

Стадія 3: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[транс-3-(4-метоксифеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

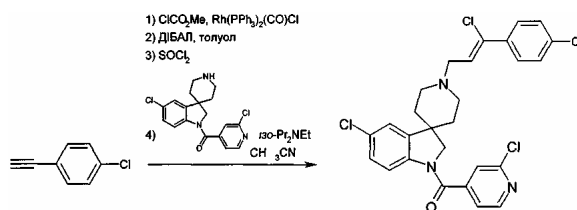
Алкилування 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,43г) 1-((E)-3-хлорпропеніл)-4-метоксибензолом, отриманим на стадії 2 (0,22г), здійснювали за методом, описаним у в прикладі 101, стадія 4, з одержанням 0,36г вказаної в заголовку сполуки (59%), яку характеризували її мас- і ЯМР-спектрами.

МС (ES+) 509.

$t_{пл}$ 83-85°C.

Приклад 11

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-115, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-хлорфеніл)-3-хлораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання метилового ефіру (Z)-3-хлор-3-(4-хлорфеніл)акрилової кислоти

Сполуку на цій стадії одержували аналогічно до методу, описаного в [M. Tanaka і ін., J. Am. Chem. Soc. 120, 1998, с.12365]:

До розчину 4-хлорфенілацетилену (100мг) і Rh(CO)(PPh₃)₂Cl (5мг) у толуолі (3мл) додавали метилхлорформіат (0,17мл) і суміш протягом 10год перемішували в запаяній трубці при 110°C. Потім реакційну суміш концентрували у вакуумі і піддавали колонковій хроматографії (SiO₂, суміш етилацетат/циклогексан у співвідношенні 1:9) з одержанням 104мг цільового продукту у вигляді коричневої твердої речовини (61%), яку характеризували її мас- і ЯМР-спектрами.

$t_{пл}$ 40°C.

Стадія 2: Одержання (Z)-3-хлор-3-(4-хлорфеніл)проп-2-ен-1-олу

За методикою, описаною в прикладі 8, стадія 2, метиловий ефір (Z)-3-хлор-3-(4-хлорфеніл)акрилової кислоти (462мг) перетворювали в цільовий продукт (391мг, 96%), який характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 3: Одержання 1-хлор-4-((Z)-1,3-дихлорпропеніл)бензолу

До розчину (Z)-3-хлор-3-(4-хлорфеніл)проп-2-ен-1-олу (101мг) у толуолі (3мл) додавали тіонілхлорид (0,11мл) і одну краплю диметилформаміду. Через 1год розчин концентрували у вакуумі з одержанням 120мг цільового алілхлориду (100%) у вигляді безбарвного масла.

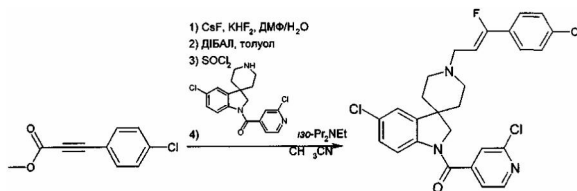
Стадія 4: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-хлорфеніл)-3-хлораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

Алкилування 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлорспіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,18г) 1-хлор-4-((Z)-1,3-дихлорпропеніл)бензолом, отриманим на стадії 3 (0,11г), здійснювали за методом, описаним в прикладі 101, стадія 4, з одержанням 0,17г вказаної в заголовку сполуки (64%) у вигляді піни, яку характеризували її мас- і ЯМР-спектрами.

МС (ES+) 548.

Приклад 12

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-90, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(2)-3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



Стадія 1: Одержання метилового ефіру (Z)-3-(4-хлорфеніл)-3-фторакрилової кислоти

Сполуку на цій стадії одержували аналогічно до методу, описаного в, [J. Cousseau, J. Chem. Soc. Chem. Commun. 1989, с.1493]:

До розчину метилового ефіру (4-хлорфеніл)пропіонової кислоти (5,36г) у диметилформаміді (60мл) додавали фторид цезію (11,4г) і гідрофторид калію (2,73г) у воді (5,4мл) і суміш перемішували при 80°C протягом 8год. Після цього реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, розбавляли етилацетатом (50мл), органічну фазу промивали водою (3x50мл) і розсоллом (3x20мл), сушили над сульфатом натрію і концентрували у вакуумі. Залишок очищали колонковою хроматографією (SiO₂, суміш етилацетат/циклогексан у співвідношенні 1:9) з одержанням 1,06г цільового продукту (20%), який характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

Стадія 2: Одержання (Z)-3-(4-хлорфеніл)-3-фторпроп-2-ен-1-олу

Стадія 3: Одержання 1-хлор-4-((Z)-3-хлор-1-фторпропеніл)бензолу

Стадія 4: Одержання 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

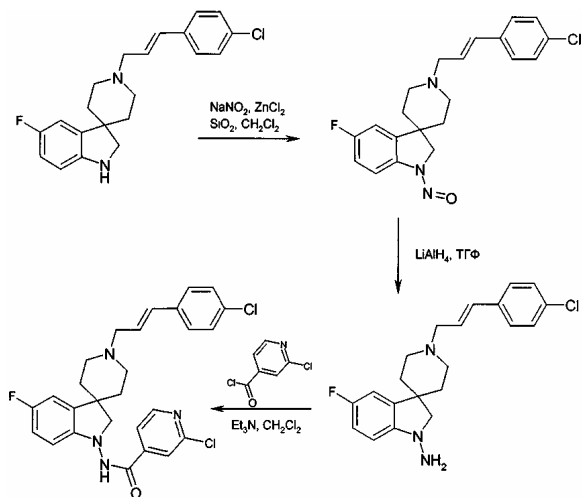
Стадії 2-4 проводили відповідно до стадій 2-4 прикладу 11 з одержанням 163мг цільового продукту (42%), який характеризували його мас- і ЯМР-спектрами.

МС (ES+) 531.

За стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 12, одержували сполуки XXX-88 і XXX-90.

Приклад 13

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-121 і сполуки XXX-94, яка представляє собою 2-хлорпірид-4-илкарбоксамідо-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] одержували аналогічно до прикладу 4, стадії 1-4.

Стадія 1: Одержання сполуки XXX-121, яка представляє собою 1-нітроз-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин]

Розчин

5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (5г) у дихлорметані (15мл) додавали до суспензії вологого силікагелю (50мас.% у воді, 2,9г) і хлориду цинку (5,73г) у дихлорметані (15мл) і отриману суміш перемішували протягом 3,5год при кімнатній температурі. Потім реакційну суміш розбавляли етилацетатом і залишок, який не розчинився, видаляли фільтрацією. Фільтрат промивали насиченим водним розчином бікарбонату натрію, водою і розсоллом, сушили над сульфатом натрію і розчинники випарювали у вакуумі з одержанням 5,13г (95%) цільового нітрозаміну у вигляді твердої речовини.

МС (ES+) 386.

Стадія 2: Одержання 1-аміно-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

Розчин 1-нітроз-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (5г) у тетрагідрофурані (60мл) при 0°C по краплях додавали до суспензії алюмогідриду літію (1,47г) у тетрагідрофурані (60мл) і отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2,5год. Після цього обережно додавали воду (4,8мл), потім 15%-ний водний гідроксид натрію (4,8мл) і на завершення воду (14,4мл). Суміш перемішували протягом 0,5год, розбавляли етилацетатом, сушили над сульфатом натрію і фільтрували. Розчинники випарювали у вакуумі з одержанням 5,1г (100%) цільового аміноіндоліну у вигляді твердої речовини.

МС (ES+) 372.

Стадія 3: Одержання 2-хлорпірид-4-илкарбоксамідо-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину]

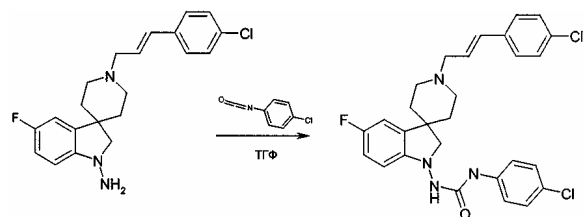
2-хлорізонікотиніолхлорид (1,2г) при кімнатній температурі додавали до перемішаного розчину 1-аміно-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,2г) і триетиламіну (0,3мл) у дихлорметані (4мл). Потім суміш перемішували протягом 2год. Після цього реакційну суміш промивали водою і водний шар екстрагували дихлорметаном. Об'єднані органічні шари сушили (сульфат натрію), фільтрували й упарювали. Сирий продукт очищали хроматографією [SiO₂, суміш етилацетат/метанол (у співвідношенні 96:4)] з одержанням 0,13г (48%) цільового продукту.

МС(ES+)511.

За стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 13, одержували сполуки XXX-95, XXX-97, XXX-98 і XXX-99.

Приклад 14

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-119, яка представляє собою 1-(4-хлорфеніл)карбамідо-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



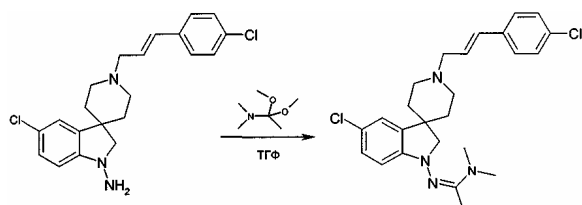
До розчину 1-аміно-5-фтор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,2г) у тетрагідрофурани (2мл) додавали 4-хлорфенілізоціанат (70мг) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 10хв. Після цього розчинник випарювали у вакуумі і залишок очищали препаративною РХВР з одержанням вказаної в заголовку сполуки (49%) у вигляді твердої речовини.

МС (ES+) 525.

За стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 14, одержували сполуки XXX-100, XXX-101, XXX-102 і XXX-103.

Приклад 15

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-102, яка представляє собою N'-[5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1-ил]-N,N-диметилацетамідин.

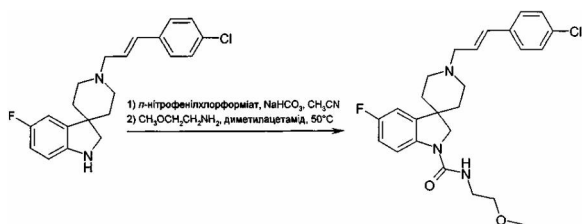


До розчину 1-аміно-5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидину] (0,15г) у тетрагідрофурани (2мл) додавали N,N-диметилацетаміддиметилацеталь (0,2г) і суміш перемішували при 70°C протягом 24год. Після цього розчинник випарювали у вакуумі і залишок очищали хроматографією [SiO₂, суміш етилацетат/метанол (у співвідношенні 9:1)] з одержанням 35мг (20%) цільового продукту.

МС (ES+) 457.

Приклад 16

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-105, яка представляє собою 2-метоксietiламід 5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1-карбонової кислоти.



До суспензії бікарбонату натрію (1,7г) в ацетонітрилі (45мл) додавали 5-хлор-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин] (2,5г) і отриману суміш охолоджували до 0°C. Після цього по краплях додавали 4-нітрофенілхлорформіат (2,54г) і отриманий розчин перемішували при 0°C протягом 2год. 3мл цього розчину додавали до розчину 2-метоксietiламіну (315мг) і триетиламіну (0,3мл) у диметилформаміді (10мл) і отриману суміш перемішували при 50°C протягом 3год. Потім розчин охолоджували до кімнатної температури,

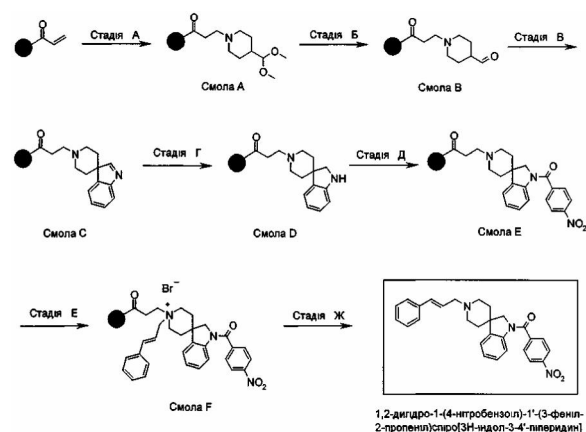
зливали у воду і тричі екстрагували етилацетатом. Органічну фазу сушили над сульфатом натрію, фільтрували і розчинники видаляли у вакуумі. Залишок очищали за допомогою РХВР зі оберненою фазою з одержанням цільового продукту (вихід 57%).

МС (ES+) 458.

За стандартними методами, аналогічними до описаних в прикладі 16, одержували сполуки XXX-104, XXX-106, XXX-107, XXX-108, XXX-109, XXX-110, XXX-111 і XXX-112.

Приклад 17

Одержання сполуки XXVI-1, яка представляє собою 1,2-дигідро-1-(4-нітробензоіл)-1'-(3-феніл-2-пропеніл)спіро[3H-індол-3,4'-піперидин].



У наступному докладному описі методів під стандартною процедурою промивання мається на увазі промивання в наступній послідовності: диметилформамідом, дихлорметаном, диметилформамідом, дихлорметаном, метанолом, дихлорметаном, метанолом (x2), трет-бутилметиловим ефіром (x2), а стандартна витрата розчинника, який використовується для набрякання смоли, становить 10мл на грам смоли. Характерні риси і чистоту вибірових сполук визначали шляхом комбінованого аналізу, заснованого на рідинній хроматографії високого розділення в сполученні з мас-спектрометрією (РХВР-МС), а також методом ядерного магнітного резонансу (¹H-ЯМР). REM-смолу одержували з комерційно доступної (гідроксиметил)полістирольної смоли й акрилоїлхлориду. Завантаження смол протягом усього процесу синтезу є постійним і дорівнює 1,2ммоль/г.

Стадія А: Вбудовування 4-форміліпiperидиндиметилацеталю в REM-смолу (смола А)

REM-смолу (10г, 12ммолів) піддавали набряканню в диметилформаміді (100мл). Після цього додавали розчин 4-форміліпiperидиндиметилацеталю (2,86г, 18ммолів) у диметилформаміді (10мл). Реакційну суміш струшували при кімнатній температурі протягом 18год. Потім отриману смолу фільтрували, промивали відповідно до стандартної процедури промивання і сушили у вакуумі з одержанням 11,83г (вихід 96%) цільової смоли А.

Стадія Б: Одержання 4-формілпіперидину на твердому носії (смола Б)

До смоли А (10г, 12ммоль) додавали 100мл розчину трифтороцтової кислоти в дихлорметані/воді (у співвідношенні 49:49:2) і потім суміш струшували при кімнатній температурі протягом 2год. Після цього отриману смолу фільтрували, промивали з використанням дихлорметану (×3), метанолу, дихлорметану, метанолу, трет-бутилметилового ефіру (×2) і сушили у вакуумі з одержанням 9,48г цільової смоли В, яку зберігали при -50°C в атмосфері азоту.

Стадія В: Одержання спіро[3Н-індол-3,4'-піперидину] на твердому носії (смола С)

До смоли В (1г, 1,2ммоль) додавали 5%-ний розчин трифтороцтової кислоти в дихлорметані (10мл), після чого додавали анізол (0,0026г, 0,024ммоль). Суміш дегазували азотом протягом 10хв і додавали фенілгідрозин (0,39г, 3,6ммоль). Реакційну суміш перемішували в атмосфері азоту і нагрівали зі зворотним холодильником протягом 36год. Після цього суміш фільтрували, промивали відповідно до стандартної процедури промивання і сушили у вакуумі з одержанням 1,09г цільової смоли С, яку відразу ж використовували на стадії Г.

Стадія Г: Одержання 1,2-дигідроспіро[3Н-індол-3,4'-піперидину] на твердому носії (смола D)

До смоли С (1г, 1,2ммоль) після її набрякання в безводному дихлорметані (10мл) додавали триацетоксиборгідрид натрію (0,51г, 2,4ммоль) у вигляді твердої речовини. Реакційну суміш протягом 2год перемішували при кімнатній температурі в атмосфері азоту. Після цього смолу фільтрували, промивали відповідно до стандартної процедури промивання і сушили у вакуумі з одержанням 0,95г цільової смоли D, яку зберігали при -50°C в атмосфері азоту.

Стадія Д: Одержання 1,2-дигідро-1-(4-нітробензоїл)спіро[3Н-індол-3,4'-піперидину] на твердому носії (смола E)

Смолу D (0,5г, 0,6ммоль) піддавали набряканню в безводному дихлорметані (5мл). Потім до суміші додавали 4-нітробензоїлхлорид (0,33г, 1,8ммоль) і N,N-діізопропілетиламін (0,42мл, 2,4ммоль). Після струшування при кімнатній температурі протягом 18год смолу фільтрували, промивали відповідно до стандартної процедури промивання і сушили у вакуумі з одержанням 0,53г цільової смоли E.

Стадія Е: Кватернізація 1,2-дигідро-1-(4-нітробензоїл)спіро[3Н-індол-3,4'-піперидину] на твердому носії (смола F)

До смоли E (0,1г, 0,12ммоль) у безводному диметилформаміді (1мл) додавали цинамілбромід (0,12г, 0,6ммоль). Реакційну суміш струшували при кімнатній температурі протягом 48год. Потім отриману смолу промивали відповідно до стандартної процедури промивання з одержанням 0,11г цільової смоли F, яку відразу ж використовували на стадії Ж.

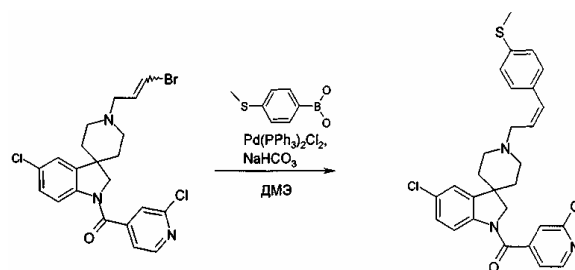
Стадія Ж: Одержання 1,2-дигідро-1-(4-нітробензоїл)-1'-(3-феніл-2-пропеніл)спіро[3Н-індол-3,4'-піперидину]

До смоли F (0,11г, 0,132ммоль) у безводному диметилформаміді (1,1мл) додавали амберліт IRA-93 (попередньо промитий 10%-ним N,N-діізопропілетиламіном у диметилформаміді) (0,11г). Суміш струшували при кімнатній температурі протягом 36год. Потім збирали диметилформамідний фільтрат і концентрували при зниженому тиску. Після цього смолу промивали дихлорметаном і метанолом. Далі об'єднували усі фільтрати і концентрували у вакуумі з одержанням 0,052г (вихід 88%) цільової сполуки у вигляді ясно-жовтого масла.

Аналогічним шляхом одержували інші сполуки, включаючи сполуку XVI-21, яка представляє собою 5-хлор-1,2-дигідро-1-(4-нітробензоїл)-1'-(3-феніл-2-пропеніл)спіро[3Н-індол-3,4'-піперидин].

Приклад 18

У цьому прикладі описане одержання сполуки XXX-72, яка представляє собою 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(Z)-3-(4-метилтіофеніл)аліл]спіро[індолін-3,4'-піперидин].



До 13,1мг 4-тіометилборонової кислоти в "Zisser-block" додавали 14,5мг 1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-5-хлор-1'-[(E/Z)-3-бромаліл]стро[індолін-3,4'-піперидину] у 0,05мл диметоксигетану, 8мг бікарбонату натрію в 0,3мл H₂O і 2мг дихлориду біс(трифенілфосфін)паладію(II). Потім суміш перемішували при 75°C протягом 13год. Після цього органічний шар відокремлювали й упарювали у вакуумі і залишок очищали хроматографією (градієнт співвідношення H₂O/ацетонітрил) з одержанням цільового продукту.

МС (ES+) 525.

Аналогічним шляхом одержували інші сполуки, включаючи сполуки XXX-1-4, XXX-51, XXX-52, XXX-53, XXX-54, XXX-55, XXX-56, XXX-57, XXX-58, XXX-59, XXX-60, XXX-61, XXX-62, XXX-63, XXX-64, XXX-65, XXX-66, XXX-67, XXX-68, XXX-69, XXX-70, XXX-71, XXX-73, XXX-74, XXX-75, XXX-76, XXX-77, XXX-78, XXX-79, XXX-80, XXX-81, XXXI-3, XXXI-5, XXXI-6 і XXXI-7.

Приклад 19

У цьому прикладі описані пестицидні/інсектицидні властивості сполук формули (I). Дію сполук проти різних шкідників визначали проведенням описаних нижче дослідів.

Дія проти *Spodoptera littoralis* (гусениця єгипетської совки бавовняної) Шматочки листів бавовнику поміщали на агар у 24-лучковому титраційному мікропланшеті й обприскували тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 200част./млн. Після висихання шматочки

листіків заражали 5-ма гусеницями вікової стадії L₁. Через 3 дні після обробки оцінювали смертність гусениць, відлякуючу дію на гусениць, харчову поведінку гусениць і регулюючу ріст дію. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Spodoptera littoralis*: I-2, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-182, I-192, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262, I-282, II-62, V-22, VI-22, VI-62, VI-202, X-22, X-62, XI-62, XII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22, XVII-62, XVIII-22, XIX-22, XIX-202, XX-22, XX-62, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXVI-2, XXVI-22, XXVII-2, XXVII-22, XXIX-43, XXIX-93, XXIX-195, XXIX-196, XXIX-201, XXX-10, XXX-106, XXX-107, XXX-118, XXX-15, XXX-16, XXX-18, XXX-24, XXX-26, XXX-28, XXX-3, XXX-36, XXX-43, XXX-48, XXX-49, XXX-52, XXX-55, XXX-57, XXX-60, XXX-67, XXX-83, XXX-84, XXX-87, XXX-88, XXX-99, XXXI-8, XXXII-4, XXX-104, XXX-105, XXX-109, XXX-112, XXX-113, XXX-114, XXX-117, XXX-12, XXX-13, XXXI-4, XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-30, XXX-38, XXX-39, XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-44, XXX-45, XXX-50, XXX-53, XXX-59, XXX-6, XXX-61, XXX-62, XXX-65, XXX-7, XXX-70, XX-8, XXX-82, XXX-89, XXX-95, XXXI-2, XXXI-7, XXX-11, XXXI-1, XXX-110, XXX-111, XXX-31, XXX-51, XXX-66, XXX-86, XXX-93 і XXXI-5.

Дія проти *Heliothis virescens* (гусениця тютюнової листовійки-брунькоїда) Яйця шкідника (через 0-24 год після кладки) поміщали в 24-лунковий титраційний мікропланшет зі штучним живильним середовищем і за допомогою піпетки обробляли тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 200 част./млн. Після 4-денного інкубаційного періоду оцінювали загибель яєць, смертність гусениць і регулюючу ріст дію. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Heliothis virescens*: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-171, I-182, I-192, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262, I-282, I-292, II-301, II-22, II-62, V-21, V-22, V-62, V-192, V-202, VI-1, VI-22, VI-62, VI-101, VI-202, IX-62, X-22, X-62, XI-62, XII-22, XIII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22, XVII-62, XVIII-22, XVIII-202, XIX-22, XIX-202, XX-22, XX-62, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXV-222, XXVI-2, XXVI-22, XXVII-2, XXVIII-22, XXVIII-7, XXVIII-27, XXVIII-42, XXVIII-67, XXVIII-97, XXVIII-132, XXVIII-187, XXVIII-217, XXVIII-252, XXIX-1, XXIX-7, XXIX-13, XXIX-57, XXIX-63, XXIX-75, XXIX-81, XXIX-87, XXIX-93, XXIX-111, XXIX-117, XXIX-123, XXIX-129, XXIX-141, XXIX-147, XXIX-153, XXIX-159, XXIX-165, XXIX-171, XXIX-183, XXIX-195, XXIX-196, XXIX-201, XXX-100, XXX-107, XXX-108, XXX-109, XXX-116, XXX-14, XXX-15, XXX-17, XXX-23, XXX-32, XXX-35, XXX-4, XXX-43, XXX-46, XXX-55, XXX-56, XXX-63, XXX-64, XXX-7, XXX-71, XXX-72, XXX-73, XXX-76, XXX-77, XXX-78, XXX-79, XXX-80, XXX-81, XXX-85, XXX-88, XXX-92, XXX-94, XXX-98, XXXII-1, XXXII-2, XXXII-3, XXXII-5, XXXII-8, XXXII-9, XXX-1, XXX-10, XXX-105, XXX-106, XXX-112, XXX-115, XXX-118, XXX-12, XXX-16, XXX-18, XXX-19, XXX-21, XXX-22, XXX-24, XXX-26, XXX-28, XXX-29, XXX-33, XXX-34, XXX-37, XXX-50, XXX-54, XXX-58, XXX-60, XXX-65, XXX-67, XXX-68, XXX-74, XXX-75, XXX-83, XXX-87, XXX-9, XXX-91, XXX-93,

XXX-96, XXX-99, XXXI-3, XXXI-6, XXXII-10, XXXII-4, XXXII-6, XXXI-1, XXX-110, XXX-111, XXX-113, XXX-114, XXX-117, XXX-13, XXXI-4, XXX-2, XXX-20, XXX-3, XXX-30, XXX-31, XXX-36, XXX-38, XXX-40, XXX-41, XXX-44, XXX-45, XXX-48, XXX-49, XXX-5, XXX-53, XXX-57, XXX-59, XXX-6, XXX-61, XXX-62, XXX-7, XXX-8, XXX-82, XXX-89, XXX-90, XXXI-2, XXX-120 і XXXI-7.

Дія проти *Plutella xylostella* (міль капустяна)

24-лунковий титраційний мікропланшет зі штучним живильним середовищем за допомогою піпетки обробляли тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 18,2 част./млн. Після висихання на титраційний мікропланшет поміщали гусениць (вікової стадії L₂) (по 10-15 гусениць на лунку). Після 5-денного інкубаційного періоду оцінювали смертність гусениць, антифідингову дію і регулюючу ріст дію. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Plutella xylostella*: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-171, I-192, I-202, I-212, I-222, I-242, I-252, I-262, I-282, I-292, II-22, II-62, V-22, V-62, V-202, VI-22, VI-62, IX-62, X-22, X-62, XI-62, XII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22, XVII-62, XX-22, XXI-62, XXII-22, XXV-62, XXVI-2, XXVI-22, XXVII-1, XXVII-2, XXVII-22, XXVIII-97, XXVIII-187, XXIX-129, XXIX-135, XXIX-159, XXIX-177, XXIX-189, XXIX-195, XXIX-196, XXX-10, XXX-100, XXX-109, XXX-112, XXX-117, XXX-16, XXX-18, XXX-19, XXX-21, XXX-28, XXX-34, XXX-36, XXX-43, XXX-48, XXX-5, XXX-50, XXX-54, XXX-59, XXX-60, XXX-66, XXX-68, XXX-69, XXX-75, XXX-83, XXX-90, XXX-91, XXX-98, XXXI-2, XXXI-7, XXXII-4, XXXII-8, XXXII-9, XXX-101, XXX-104, XXX-107, XXX-110, XXX-111, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXXI-4, XXX-22, XXX-3, XXX-30, XXX-37, XXX-39, XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-44, XXX-49, XXX-57, XXX-61, XXX-7, XXX-89, XXX-105, XXX-106, XXXI-1, XXX-113, XXX-114, XXX-31, XXX-35, XXX-38, XXX-45, XXX-46, XXX-47, XXX-53, XXX-62, XXX-67, XXX-70, XXX-8, XXX-86, XXXI-5, XXX-2, XXX-120 і XXX-51.

Дія проти *Myzus persicae* (попелиця персикова зелена)

Шматочки листків соняшника поміщали на агар у 24-лунковому титраційному мікропланшеті й обприскували тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 200 част./млн. Після висихання шматочки листя заражали популяцією попелиці, що складалася з особин різного віку. Після закінчення інкубаційного періоду тривалістю 6 днів після обробки оцінювали смертність шкідника. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Myzus persicae*: I-2, I-21, II-62, XI-62, XXVII-2, XXVIII-162, XXIX-49, XXX-111, XXX-13, XXX-29, XXX-34 і XXX-47.

Дія проти *Tetranychus urticae* (кліщ дволяпистий павутинний)

Шматочки листів бобу, поміщені на агар у 24-лунковому титраційному мікропланшеті, обприскували тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 200 част./млн. Після висихання шматочки листя заражали популяцією кліща, що складалася з особин різного віку. Через 8 днів шматочки листів оцінювали на

загибель яєць, смертність гусениць і смертність дорослих особин. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Tetranychus urticae*: I-202, XIII-22, XIX-202, XXVI-1, XXVIII-162, XXIX-207, XXX-57 і XXXI-2.

Дія проти *Aedes aegypti* (жовтогарячковий комар)

По 10-15 личинок *Aedes aegypti* (вікової стадії L₂) поміщали разом з живильною сумішшю на 96-лункові титраційні мікропланшети. Після цього лунки за допомогою піпетки обробляли тестованими розчинами з концентрацією діючої речовини 2 част./млн. Через 2 дні оцінювали смертність комах і гальмування їх росту. Наступні сполуки виявили принаймні 80%-ну ефективність при боротьбі з *Aedes aegypti*: I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262, I-292, II-22, II-62, V-22, VI-22, VI-62, VI-202, XIV-22, XV-22, XVII-62, XVIII-22, XIX-22, XX-22, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXVI-2, XXVI-22, XXVII-22, XXVIII-7, XXVIII-27, XXVIII-67, XXVIII-97, XXVIII-187, XXIX-13, XXIX-19, XXIX-25, XXIX-31, XXIX-37, XXIX-69, XXIX-75, XXIX-93, XXIX-99, XXIX-105, XXIX-117, XXIX-123, XXIX-129, XXIX-135, XXIX-159, XXIX-183, XXX-102, XXX-105, XXX-11, XXX-110, XXX-117, XXX-24, XXX-28, XXX-31, XXX-34, XXX-4, XXX-48, XXX-49, XXX-52, XXX-57, XXX-59, XXX-60, XXX-61, XXX-67, XXX-68, XXX-7, XXX-70, XXX-75, XXX-78, XXX-79, XXX-82, XXX-83, XXX-84, XXX-87, XXX-88, XXX-90, XXX-93, XXX-94, XXX-97, XXXI-2, XXXI-7, XXXI-8, XXXII-10, XXXII-4, XXX-104, XXX-106, XXXI-1, XXX-111, XXX-113, XXX-114, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXXI-4, XXX-16, XXX-17, XXX-18, XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-22, XXX-26, XXX-3, XXX-30, XXX-35, XXX-38, XXX-39, XXX-44, XXX-46, XXX-47, XXX-5, XXX-50, XXX-53, XXX-62, XXX-86, XXX-98, XXXI-5, XXX-109, XXX-45, XXX-51, XXX-6, XXX-66 XXX-121 і XXX-8.