



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 106253

(13) C2

(51) МПК (2014.01)

C07D 215/14 (2006.01) A01N 43/42 (2006.01)

A01N 55/00

A01P 3/00

C07D 215/18 (2006.01) C07D 215/20 (2006.01)

C07D 215/38 (2006.01) C07D 221/04 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)

C07D 491/048 (2006.01) C07D 495/04 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: **а 2012 07713**

(22) Дата подання заявки: **28.12.2010**

(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: **11.08.2014**

(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **2010-000194**

(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **04.01.2010**

(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: **JP**

(41) Публікація відомостей про заявку: **10.09.2012, Бюл.№ 17**

(46) Публікація відомостей про видачу патенту: **11.08.2014, Бюл.№ 15**

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: **PCT/JP2010/073683, 28.12.2010**

(72) Винахідник(и):
**Шібаяма Котаро (JP),
Інагакі Джун (JP),
Саїкі Юто (JP),
Мітани Акіра (JP),
Кувахара Ріто (JP),
Сато Мотоакі (JP),
Нішімура Сатоші (JP),
Кубокі Мамі (JP)**

(73) Власник(и):
НІППОН СОДА КО., ЛТД.,
2-1, Ohtemachi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8165, Japan (JP)

(74) Представник:
Коваль Максим Павлович, реєстр. №208

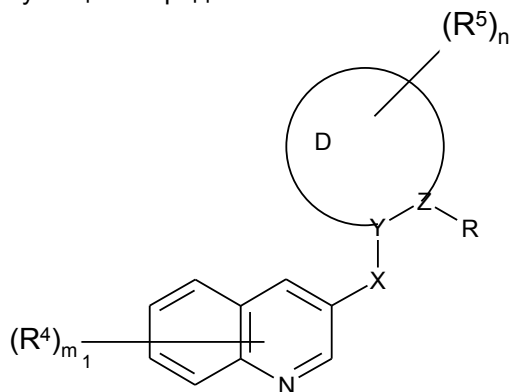
(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:
JP 2008-521872, A, 26.06.2008
JP 2008-88139, A, 17.04.2008
WO 2009021696, A1, 19.02.2009
WO2006098308, A1, 21.09.2006
WO2007117180, A1, 18.10.2007
JP 2006-507336, A, 02.03.2006
JP, 2005-531518, A, 20.10.2005
JP 2004-514663, A, 20.05.2004
WO 2008068270, A1, 12.06.2008
US 20060211739, A1, 21.09.2006
WO 2003063861, A1, 07.08.2003
JP 2009-507024, A, 19.02.2009
JP 2008-528590, A, 31.07.2008
JP 10-67746, A, 10.03.1998
CALAWAY, P. K.: 'Utilization of Aryloxy Ketones in the Synthesis of Quinolines by the Pfitzinger Reaction' JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY vol. 61, no. 6, 1939, pages 1355 - 1358
ROYER, R.: 'Sur la formation des aldehydes aromatiques par pyrodecomposition des aryloxyacetophenones' HELVETICA CHIMICA ACTA vol. 42, no. 7, 1959, pages 2364 - 2370
RUIZ, J.: 'Intramolecular cyclisation of functionalised heteroarylithiums.' SYNTHESIS OF NOVEL INDOLIZINONE-BASED COMPOUNDS, TETRAHEDRON vol. 62, no. 26, 2006, pages 6182 - 6189
CHAN, D. C. M.: 'Design, Synthesis, and Antifolate Activity of New Analogues of Piritrexim and Other Diaminopyrimidine Dihydrofolate Reductase Inhibitors with w-Carboxyalkoxy or w-Carboxy-1-a1kyny1 Substitution in the Side Chain' JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY vol. 48, no. 13, 2005, pages 4420 - 4431
WO 9217452, A1, 15.10.1992

UA 106253 C2

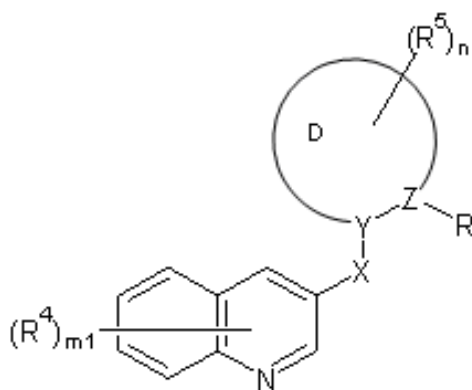
(54) АЗОТВІСНА ГЕТЕРОЦИКЛІЧНА СПОЛУКА І СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИЙ ФУНГІЦИД

(57) Реферат:

Описаний сільськогосподарський фунгіцид, що містить принаймні одну сполуку, яку вибирають з групи, яка містить нову азотвмісну гетероциклічну сполуку, представлену Формулою (II), її сіль або N-оксид сполуки. У Формулі (II), R представляє групу, представлену $CR^1R^2R^3$ або ціаногрупу. R^1 - R^5 , D мають значення, як у формулі винаходу. Y або Z являє собою атом вуглецю. X представляє атом кисню



формула (II).



Галузь винаходу

Представлений винахід стосується нової азотвмісної гетероциклічної сполуки і сільськогосподарського фунгіциду, що містить принаймні одну сполуку з групи, яка містить азотвмісні гетероциклічні сполуки як активний інгредієнт.

5 Пріоритет заявлений в Японській патентній заявці № 2010-000194, що подана 4 січня 2010, вміст якої включений сюди як посилання.

Передумови створення винаходу

10 При вирощуванні сільськогосподарських культур, для боротьби з захворюваннями культур використовують різні контролюючі агенти. Однак, існує дуже небагато агентів, що здатні повністю задовольнити потребу в контролюючому агенті, що обумовлено недостатньою контролюючою дією, обмеженою застосовуваністю внаслідок надзвичайної стійкості патогенів, фітотоксичності або забруднюючої дії на рослини, або токсичності для людей, домашніх тварин і риб і шкідливої дії на оточуюче середовище. Крім того, необхідні агенти, що мають незначні

15 недоліки цього виду і які є безпечними для використання. Стосовно представленого винаходу, в наступному Патентному документі 1 або 2, описуються похідні хіноліну, що мають подібні хімічні структури до сполук згідно з представленим винаходом і сільськогосподарські фунгіциди, що містять похідні хіноліну як активні інгредієнти.

Документи рівня техніки

20 Патентні документи

[Патентний документ 1] Реферат WO2005/070917

[Патентний документ 2] Реферат WO2007/011022

Короткий опис винаходу

Проблеми, що вирішуються винаходом

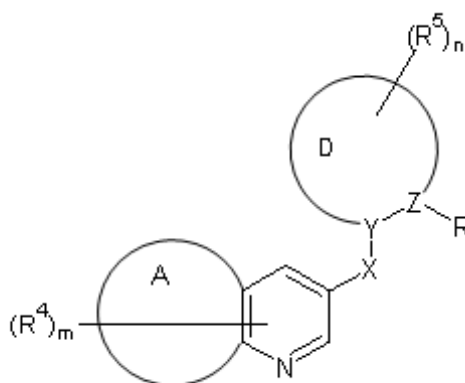
25 Ціллю представленого винаходу є одержання нової азотвмісної гетероциклічної сполуки і її солі або N-оксиду сполуки і сільськогосподарського фунгіциду, що має надійну дію, є безпечним при використанні і містить, принаймні, одну сполуку з групи, що містить азотвмісну гетероциклічну сполуку, її сіль і N-оксид, як активний інгредієнт.

Засоби вирішення проблем

30 Винахідниками були проведені інтенсивні дослідження для вирішення згаданих вище проблем. Як результат, одержали азотвмісну гетероциклічну сполуку представлену Формулою (I), її сіль або N-оксид сполуки. Також було встановлено, що азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки є корисними як активний інгредієнт сільськогосподарського фунгіциду, що має надійну дію і є безпечним при застосуванні. Представлений винахід був

35 створений після досліджень на основі цих відкриттів. Тобто, представлений винахід включає наступні аспекти.

<1> Азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (I), її сіль або N-оксид сполуки.



Формула (I)

40 У Формулі (I), R представляє групу представлену $CR^1R^2R^3$, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу або ціаногрупу;

45 $R^1 - R^3$ кожен незалежно представляє атом водню, незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або

заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщену сульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

- 5 за винятком, коли: $R^1 - R^3$ всі є атомами водню; $R^1 - R^3$ всі є незаміщеними C_{1-8} алкільними групами; будь-який один з $R^1 - R^3$ є атом водню і два, що залишились, обидва є незаміщеними C_{1-8} алкільними групами; і, будь-який один з $R^1 - R^3$ є незаміщеною C_{1-8} алкільною групою і два, що залишились, обидва є атомами водню;

R^1 і R^2 можуть бути зв'язані, утворюючи незаміщене або заміщене 5-8-членне кільце, або утворюючи $O=$, $R^a R^b C=$ або $R'-N=$;

- 10 R^a представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу;
 R^b представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу;
 R' представляє незаміщену або заміщену гідроксильну групу або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу;

- 15 R^4 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщену сульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

m представляє кількість R^4 і є цілим числом від 0 до 6;

- 25 R^5 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщену сульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

n представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 5;

- 35 будь-який один з $R^1 - R^3$ і будь-який один з R^5 можуть бути зв'язані, утворюючи незаміщене або заміщене 5-8-членне кільце;

A представляє: 5-7-членне вуглеводневе кільце або 5-7-членне гетероциклічне кільце, коли R є групою представленою $CR^1 R^2 R^3$; або бензольне кільце, коли R є незаміщеною або заміщеною C_{6-10} арильною групою або ціаногрупою;

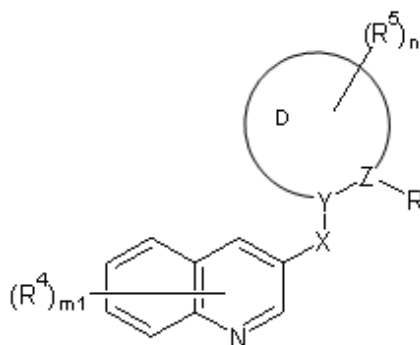
D представляє 5-7-членне вуглеводневе кільце або 5-7-членне гетероциклічне кільце;

- 40 X представляє атом кисню, атом сірки, сульфенільну групу, сульфонільну групу, незаміщений або заміщений атом вуглецю або незаміщений або заміщений атом азоту;

Y представляє атом вуглецю або атом азоту; і

Z представляє атом вуглецю або атом азоту.

- 45 <2> Азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (II), її сіль або N-оксид сполуки.

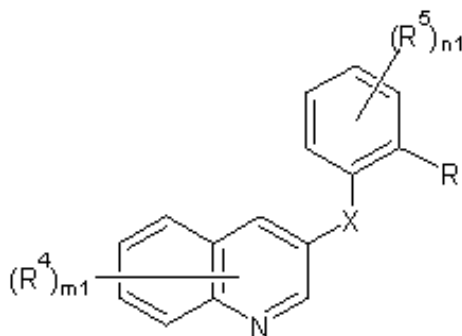


Формула (II)

У Формулі (II), кожен з R , R^4 , R^5 , n , D , X , Y , і Z має таке ж саме значення як ті, що приведені у Формулі (I) описаній вище в <1>; і

m1 представляє кількість R^4 і є цілим числом від 0 до 6.

<3> Азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (III), її сіль або N-оксид сполуки.



Формула (III)

У Формулі (III), кожен з R , R^4 , R^5 , $m1$ і X має таке ж саме значення як ті, що приведені у Формулі (II) описаній вище в <2>; і

$n1$ представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 4.

<4> Сільськогосподарський фунгіцид, що містить, як активний інгредієнт, принаймні одну сполуку, що вибирають з групи, яка містить азотвмісну гетероциклічну сполуку, її сіль і N-оксид сполуки, за будь-яким одним з <1> - <3>.

<5> Проміжна сполука азотвмісної гетероциклічної сполуки представленої Формулою (I), її солі або N-оксиду сполуки, описаної вище в <1>, де проміжну сполуку вибирають з групи, що містить 8-фтор-3-гідроксхінолін, 7,8-дифтор-3-гідроксхінолін, 7,8-дифтор-3-йодхінолін, 8-фтор-3-гідрокси-2-метилхінолін, і 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхінолін.

Дія винаходу

Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль і N-оксид сполуки згідно з представленим винаходом є новими сполуками корисними як активний інгредієнт сільськогосподарського фунгіциду, що має надійну дію і є безпечним при застосуванні.

Сільськогосподарський фунгіцид згідно з представленим винаходом є агентом, який має відмінну контролюючу дію, не проявляє фітотоксичність по відношенню до рослин і має низьку токсичність для людей, домашніх тварин і риб або на оточуюче середовище.

Способи здійснення винаходу

Тут далі, представлений винахід буде охарактеризований як 1) азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (I) і її сіль або N-оксид сполуки, і 2) сільськогосподарський фунгіцид і буде описаний детально.

1) Азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (I) і її сіль або N-оксид сполуки.

Азотвмісна гетероциклічна сполука згідно з представленим винаходом представлена Формулою (I) (тут далі, іноді згадується як "сполука (I)"), переважно представлена Формулою (II) (тут далі, іноді згадується як "сполука (II)"), і більш переважно представлена Формулою (III) (тут далі, іноді згадується як "сполука (III)").

Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки згідно з представленим винаходом може бути гідратом, сольватом, кристалічним поліморфом або т.і. Також, в азотвмісній гетероциклічній сполуці, її солі або N-оксиди сполуки згідно з представленим винаходом може бути присутній асиметричний атом вуглецю і існувати стереоізомери на основі подвійного зв'язку або т.і. або їх суміш.

Перш за все, буде пояснене значення "незаміщений" у Формулі (I), (II), і (III). Термін "незаміщений" в представленому описі означає, що певна група виключно утворена групою, що є частиною материнського ядра. Коли згадується тільки назва групи, що утворена материнським ядром, без згадування "заміщена", це означає "незаміщену", якщо не вказано інше.

З іншого боку, термін "заміщений" означає, що атом водню групи, що утворена ядром, замінений замісником, що має таку ж саму структуру як або іншу структуру як материнське ядро. "Замісник" є іншою групою, яка зв'язана з групою, що утворює материнське ядро. "Замісник" може бути одним або більше. Принаймні, два замісника можуть бути однаковими або різними.

Терміни, такі як " C_{1-6} " або т.і. означає, що кількість атомів вуглецю в групі, що є материнським ядром, є 1 - 6 або т.і.. Кількість атомів вуглецю не включає атоми вуглецю в

заміснику. Наприклад, бутильна група, що має епоксигрупу як замісник класифікується як C_2 алкокси C_4 алкільна група.

“Замісник” спеціально не обмежується, доки він є хімічно прийнятним і відповідає представленому винаходу.

5 Прикладами “замісника” є: атом галогену, такий як атом фтору, атом хлору, атом броду або атом йоду; C_{1-6} алкільна група, така як метильна група, етильна група, н-пропільна група, і-пропільна група, н-бутильна група, в-бутильна група, і-бутильна група, т-бутильна група, н-пентильна група, або н-гексильна група; C_{3-6} циклоалкільна група, така як циклопропільна група, циклобутильна група, циклопентильна група, або циклогексильна група; C_{2-6} алкенільна група, така як вінільна група, 1-пропенільна група, 2-пропенільна група, 1-бутенільна група, 2-бутенільна група, 3-бутенільна група, 1-метил-2-пропенільна група, 2-метил-2-пропенільна група, 1-пентенільна група, 2-пентенільна група, 3-пентенільна група, 4-пентенільна група, 1-метил-2-бутенільна група, 2-метил-2-бутенільна група, 1-гексенільна група, 2-гексенільна група, 3-гексенільна група, 4-гексенільна група, і 5-гексенільна група; C_{3-6} циклоалкенільна група, така як 2-циклопропенільна група, 2-циклопентенільна група, або 3-циклогексенільна група; C_{2-6} алкінільна група, така як етинільна група, 1-пропінільна група, 2-пропінільна група, 1-бутинільна група, 2-бутинільна група, 3-бутинільна група, 1-метил-2-пропінільна група, 2-метил-3-бутинільна група, 1-пентинільна група, 2-пентинільна група, 3-пентинільна група, 4-пентинільна група, 1-метил-2-бутинільна група, 2-метил-3-пентинільна група, 1-гексинільна група, або 1,1-диметил-2-бутинільна група;

15 C_{1-6} алкокси група, така як метокси група, етокси група, н-пропокси група, і-пропокси група, н-бутокси група, в-бутокси група, і-бутокси група або т-бутокси група; C_{2-6} алкенілокси група, така як вінілокси група, алілокси група, пропенілокси група або бутенілокси група; C_{2-6} алкінілокси група, така як етинілокси група або пропаргілокси група; C_{6-10} арильна група, така як фенільна група або нафтильна група; C_{6-10} арилокси група, така як фенокси група або 1-нафтокси група; C_{7-11} аралкільна група, така як бензильна група або фенетильна група; C_{7-11} аралкілокси група, така як бензилокси група або фенетилокси група; C_{1-7} ацильна група, така як формільна група, ацетильна група, пропіонільна група, бензоїльна група, або циклогексилкарбонільна група; C_{1-7} ацилокси група, така як формілокси група, ацетилокси група, пропіонілокси група, бензоїлокси група, або циклогексилкарбонілокси група; C_{1-6} алкоксикарбонільна група, така як метоксикарбонільна група, етоксикарбонільна група, н-пропоксикарбонільна група, і-пропоксикарбонільна група, н-бутоксикарбонільна група, і т-бутоксикарбонільна група; карбоксильна група;

30 гідроксильна група; оксогрупа; C_{1-6} галоалкільна група, така як хлорметильна група, хлоретильна група, трифторметильна група, 1,2-дихлор-н-пропільна група, 1-фтор-н-бутильна група, або перфтор-н-пентильна група; C_{2-6} галоалкенільна група, така як 2-хлор-1-пропенільна група або 2-фтор-1-бутенільна група; C_{2-6} галоалкінільна група, така як 4,4-дихлор-1-бутинільна група, 4-фтор-1-пентинільна група або 5-бром-2-пентинільна група; C_{1-6} галоалкокси група, така як 2-хлор-н-пропокси група або 2,3-дихлорбутокси група; C_{2-6} галоалкенілокси група, така як 2-хлорпропенілокси група або 3-бромбутенілокси група; C_{6-10} галоарильна група, така як 4-хлорфенільна група, 4-фторфенільна група, або 2,4-дихлорфенільна група; C_{6-10} галоарилокси група, така як 4-фторфенілокси група, або 4-хлор-1-нафтокси група; C_{1-7} галоацильна група, така як хлорацетильна група, трифторацетильна група, трихлорацетильна група, або 4-хлорбензоїльна група;

45 ціаногрупа; ізоціаногрупа; нітрогрупа; ізоціанатна група; ціанатна група; азидна група; аміногрупа; C_{1-6} алкіламіногрупа, така як метиламіногрупа, диметиламіногрупа або діетиламіногрупа; C_{6-10} ариламіногрупа, така як аніліногрупа або нафтиламіногрупа; C_{7-11} аралкіламіногрупа, така як бензиламіногрупа або фенілетиламіногрупа; C_{1-7} ациламіногрупа, така як форміламіногрупа, ацетиламіногрупа, пропаноїламіногрупа, бутириламіногрупа, і-пропілкарбоніламіногрупа або бензоїламіногрупа; C_{1-6} алкоксикарбоніламіногрупа, така як метоксикарбоніламіногрупа, етоксикарбоніламіногрупа, н-пропоксикарбоніламіногрупа або і-пропоксикарбоніламіногрупа; карбамоїльна група; заміщена карбамоїльна група, така як диметилкарбамоїльна група, фенілкарбамоїльна група або N-феніл-N-метилкарбамоїльна група; іміно C_{1-6} алкільна група, така як імінометильна група, (1-іміно)етильна група або (1-іміно)-н-пропільна група; гідроксиіміно C_{1-6} алкільна група, така як гідроксиімінометильна група, (1-гідроксиіміно)етильна група, або (1-гідроксиіміно)пропільна група; C_{1-6} алкоксиіміно C_{1-6} алкільна група, така як метоксиімінометильна група або (1-метоксиіміно)етильна група;

50 меркапто група; ізотіоціанатна група; тіоціанатна група; C_{1-6} алкілтіо група, така як метилтіо група, етилтіо група, н-пропілтіо група, і-пропілтіо група, н-бутилтіо група, і-бутилтіо група, в-бутилтіо група, або т-бутилтіо група; C_{2-6} алкенілтіо група, така як вінілтіо група або алілтіо

група; C₂₋₆ алкінілтіо група, така як етинілтіо група або пропаргілтіо група; C₆₋₁₀ арилтіо група, така як фенілтіо група або нафтилтіо група; гетероарилтіо група, така як тiazолілтіо група або піридилтіо група; C₇₋₁₁ аралкілтіо група, така як бензилтіо група або фенетилтіо група; (C₁₋₆ алкілтіо)карбонільна група, така як (метилтіо)карбонільна група, (етилтіо)карбонільна група, (н-пропілтіо)карбонільна група, (і-пропілтіо)карбонільна група, (н-бутилтіо)карбонільна група, (і-бутилтіо)карбонільна група, (в-бутилтіо)карбонільна група, або (т-бутилтіо)карбонільна група;

C₁₋₆ алкілсульфінільна група, така як метилсульфінільна група, етилсульфінільна група, або т-бутилсульфінільна група; C₂₋₆ алкенілсульфінільна група, така як алілсульфінільна група; C₂₋₆ алкінілсульфінільна група, така як пропаргілсульфінільна група; C₆₋₁₀ арилсульфінільна група, така як фенілсульфінільна група; гетероарилсульфінільна група, така як тiazолілсульфінільна група або піридилсульфінільна група; C₇₋₁₁ аралкілсульфінільна група, така як бензилсульфінільна група або фенетилсульфінільна група; C₁₋₆ алкілсульфонільна група, така як метилсульфонільна група, етилсульфонільна група, або т-бутилсульфонільна група; C₂₋₆ алкенілсульфонільна група, така як алілсульфонільна група; C₂₋₆ алкінілсульфонільна група, така як пропаргілсульфонільна група; C₆₋₁₀ арилсульфонільна група, така як фенілсульфонільна група; гетероарилсульфонільна група, така як тiazолілсульфонільна група або піридилсульфонільна група; C₇₋₁₁ аралкілсульфонільна група, така як бензилсульфонільна група або фенетилсульфонільна група;

5-членна гетероарильна група, така як піроліильна група, фурильна група, тієнільна група, імідазоліильна група, піразоліильна група, оксазоліильна група, ізоксазоліильна група, тiazоліильна група, ізотiazоліильна група, триазоліильна група, оксадіазоліильна група, тіадіазоліильна група або тетразоліильна група; 6-членна гетероарильна група, така як піридиліньна група, піразинільна група, піримідинільна група, піридазинільна група або триазинільна група; насичена гетероциклічна група, така як азиридинільна група, епоксидна група, піролідинільна група, тетрагідрофуранільна група, піперидинільна група, піперазинільна група або морфолінільна група; три C₁₋₆ алкілсилільна група, така як триметилсилільна група, триетилсилільна група або т-бутилдиметилсилільна група; трифенілсилільна група; і т.і.

“Замісник” може мати інший “замісник”.

[R]

R представляє групу представлену CR¹R²R³, незаміщену або заміщену C₆₋₁₀ арильну групу або ціаногрупу.

R¹ - R³ кожен незалежно представляє атом водню, незаміщену або заміщену C₁₋₈ алкільну групу, незаміщену або заміщену C₂₋₈ алкенільну групу, незаміщену або заміщену C₂₋₈ алкінільну групу, незаміщену або заміщену C₃₋₈ циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C₄₋₈ циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C₆₋₁₀ арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C₁₋₈ ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C₁₋₈ алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщену сульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

Однак, відсутні випадки, в яких R¹ - R³ всі є атомами водню. Також, відсутні випадки, в яких R¹ - R³ всі є незаміщеними C₁₋₈ алкільними групами. Також, коли будь-який один з R¹ - R³ є атом водню, відсутні випадки, в яких два, що залишились обидва є незаміщеними C₁₋₈ алкільними групами. Також, коли будь-який один з R¹ - R³ є незаміщеною C₁₋₈ алкільною групою, відсутні випадки, в яких два, що залишились, обидва є атомами водню.

“C₁₋₈ алкільна група” насиченим вуглеводнем, що має 1 - 8 атомів вуглецю. C₁₋₈ алкільна група може бути нерозгалуженою або розгалуженою. Прикладами C₁₋₈ алкільної групи є метильна група, етильна група, н-пропильна група, н-бутильна група, н-пентильна група, н-гексильна група, н-гептильна група, н-октильна група, і-пропильна група, і-бутильна група, в-бутильна група, т-бутильна група, і-пентильна група, неопентильна група, 2-метилбутильна група, 2,2-диметилпропильна група, і-гексильна група і т.і. Серед них, C₁₋₆ алкільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної C₁₋₈ алкільної групи” є:

циклоалкілалкільна група, така як циклопропілметильна група, 2-циклопропілетильна група, циклопентилметильна група або 2-циклогексилетильна група, переважно C₃₋₆ циклоалкіл C₁₋₆ алкільна група;

циклоалкенілалкільна група, така як циклопентенілметильна група, 3-циклопентенілметильна група, 3-циклогексенілметильна група, або 2-(3-циклогексеніл)етильна група, переважно C₄₋₆ циклоалкеніл C₁₋₆ алкільна група;

- галоалкільна група, така як фторметильна група, хлорметильна група, бромметильна група, дифторметильна група, дихлорметильна група, дибромметильна група, трифторметильна група, трихлорметильна група, трибромметильна група, 2,2,2-трифторетильна група, 2,2,2-трихлоретильна група, пентафторетильна група, 4-фторбутильна група, 4-хлорбутильна група, 3,3,3-трифторпропільна група, 2,2,2-трифтор-1-трифторметилетильна група, перфторгексильна група, перхлоргексильна група, перфтороктильна група, перхлороктильна група, 2,4,6-трихлоргексильна група, перфтордецильна група, або 2,2,4,4,6,6-гексахлороктильна група, переважно C_{1-6} галоалкільна група;
- арилалкільна група (аралкільна група), така як бензильна група, фенетильна група, 3-фенілпропільна група, 1-нафтилметильна група або 2-нафтилметильна група, переважно C_{6-10} арил C_{1-6} алкільна група;
- гетероарилалкільна група, така як 2-піридилметильна група, 3-піридилметильна група, 4-піридилметильна група, 2-(2-піридил)етильна група, 2-(3-піридил)етильна група, 2-(4-піридил)етильна група, 3-(2-піридил)пропільна група, 3-(3-піридил)пропільна група, 3-(4-піридил)пропільна група, 2-піразинілметильна група, 3-піразинілметильна група, 2-(2-піразиніл)етильна група, 2-(3-піразиніл)етильна група, 3-(2-піразиніл)пропільна група, 3-(3-піразиніл)пропільна група, 2-піримідилметильна група, 4-піримідилметильна група, 2-(2-піримідил)етильна група, 2-(4-піримідил)етильна група, 3-(2-піримідил)пропільна група, 3-(4-піримідил)пропільна група, 2-фурилметильна група, 3-фурилметильна група, 2-(2-фурил)етильна група, 2-(3-фурил)етильна група, 3-(2-фурил)пропільна група, або 3-(3-фурил)пропільна група, переважно 5-6-членна гетероарил C_{1-6} алкільна група;
- гідроксиалкільна група, така як гідроксиметильна група, 1-гідроксиетильна група, 2-гідроксиетильна група, 1-гідроксипропільна група, 3-гідроксипропільна група, 1-гідрокси-1-метилетильна група, 2-гідрокси-1,1-диметилетильна група, 2-гідрокси-1,1-диметилпропільна група, або 2-гідрокси-2-метилпропільна група, переважно гідроксил C_{1-6} алкільна група;
- алкоксиалкільна група, така як метоксиметильна група, етоксиметильна група, 2-метоксиметильна група, 2-етоксиметильна група, метокси-*n*-пропільна група, *n*-пропоксиметильна група, *i*-пропоксиметильна група, *н*-бутоксиметильна група, *т*-бутоксиметильна група, 2,2-диметоксиметильна група, або 2,2-диметокси-1,1-диметилетильна група, переважно C_{1-6} алкокси C_{1-6} алкільна група;
- ацилоксиалкільна група, така як формілоксиметильна група, ацетоксиметильна група, 2-ацетоксиметильна група, пропіонілоксиметильна група або пропіонілоксиметильна група, переважно C_{1-7} ацилокси C_{1-6} алкільна група;
- триалкілсилілоксиалкільна група, така як триметилсилілоксиметильна група або *т*-бутилдиметилсилілоксиметильна група, переважно три C_{1-6} алкілсилілокси C_{1-6} алкільна група;
- арилсульфонілоксиалкільна група, така як тозиллоксиметильна група або 2-тозилокси-1,1-диметилетильна група, переважно C_{1-6} алкіл-заміщена C_{6-10} арилсульфонілокси C_{1-6} алкільна група;
- ціаноалкільна група, така як ціанометильна група, 2-ціаноетильна група або 1-ціано-1-метилетильна група, переважно ціано C_{1-6} алкільна група;
- ацилалкільна група, така як формілметильна група, 2-формілетильна група, 3-формілпропільна група, 1-форміл-1-метилетильна група, 2-форміл-1,1-диметилетильна група, ацетилметильна група, 2-ацетилетильна група, 3-ацетилпропільна група, 1-ацетил-1-метилетильна група або 2-ацетил-1,1-диметилетильна група, переважно C_{1-6} ацил C_{1-6} алкільна група;
- 2-гідроксиіміноалкільна група, така як 2-гідроксиіміноетильна група, 2-гідроксиіміно-1-метилетильна група, 2-гідрокси-1,1-диметилетильна група або 2-гідроксиімінопропільна група, переважно 2-гідроксиіміно C_{2-6} алкільна група;
- ацилалкільна група, така як ацетилметильна група, 2-ацетилетильна група, 3-ацетилпропільна група, 1-ацетил-1-метилетильна група або 2-ацетил-1,1-диметилетильна група, переважно форміл C_{1-6} алкільна група;
- карбоксиалкільна група, така як карбоксиметильна група, 2-карбоксиетильна група, 3-карбоксипропільна група, 1-карбокси-1-метилетильна група, або 2-карбокси-1,1-диметилетильна група, переважно карбокси C_{1-6} алкільна група;
- алкоксикарбоніалкільна група, така як метоксикарбонілметильна група, 2-метоксикарбонілетильна група, 3-метоксикарбонілпропільна група, 1-метоксикарбоніл-1-метилетильна група, або 2-метоксикарбоніл-1,1-диметилетильна група, переважно C_{1-6} алкоксикарбоніл C_{1-6} алкільна група;
- азидоалкільна група, така як азидометильна група, 2-азидоетильна група або 1-азидо-1-метилетильна група, переважно азидо C_{1-6} алкільна група; і т.і.

“C₂₋₈ алкенільна група” є незаміщеною вуглеводневою групою, що має 2 - 8 атомів вуглецю і має принаймні один вуглець-вуглецевий подвійний зв'язок. C₂₋₈ алкенільна група може бути нерозгалуженою або розгалуженою. Прикладами C₂₋₈ алкенільної групи є вінільна група, 1-пропенільна група, ізопропенільна група, алільна група, 1-бутенільна група, 2-бутенільна група, 3-бутенільна група, 1-пентенільна група, 2-пентенільна група, 3-пентенільна група, 4-пентенільна група, 1-гексенільна група, 2-гексенільна група, 3-гексенільна група, 4-гексенільна група, 5-гексенільна група, 1-гептенільна група, 6-гептенільна група, 1-октенільна група, 7-октенільна група, 1-метил-алільна група, 2-метил-алільна група, 1-метил-2-бутенільна група, 2-метил-2-бутенільна група і т.і. Серед них, C₂₋₆ алкенільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної C₂₋₈ алкенільної групи” є: галоалкенільна група, така як 3-хлор-2-пропенільна група, 4-хлор-2-бутенільна група, 4,4-дихлор-3-бутенільна група, 4,4-дифтор-3-бутенільна група, 3,3-дихлор-2-пропенільна група, 2,3-дихлор-2-пропенільна група, 3,3-дифтор-2-пропенільна група або 2,4,6-трихлор-2-гексенільна група, переважно C₂₋₆ галоалкенільна група;

гідроксиалкенільна група, така як 3-гідрокси-1-пропенільна група, 4-гідрокси-1-бутенільна група, 1-гідроксиалільна група або 1-гідрокси-2-метилалільна група, переважно гідрокси C₂₋₆ алкенільна група; і т.і.

“C₂₋₈ алкінільна група” є незаміщеною вуглеводневою групою, що має 2 - 8 атомів вуглецю і має принаймні один вуглець-вуглецевий потрійний зв'язок. C₂₋₈ алкінільна група може бути нерозгалуженою або розгалуженою. Прикладами C₂₋₈ алкінільної групи є етинільна група, 1-пропінільна група, пропаргільна група, 1-бутинільна група, 2-бутинільна група, 3-бутинільна група, 1-пентинільна група, 2-пентинільна група, 3-пентинільна група, 4-пентинільна група, 1-гексинільна група, 1-метил-2-пропінільна група, 2-метил-3-бутинільна група, 1-метил-2-бутинільна група, 2-метил-3-пентинільна група, 1,1-диметил-2-бутинільна група, і т.і. Серед них, C₂₋₆ алкінільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної C₂₋₈ алкінільної групи” є галоалкінільна група, така як 3-хлор-1-пропінільна група, 3-хлор-1-бутинільна група, 3-бром-1-бутинільна група, 3-бром-2-пропінільна група, 3-йод-2-пропінільна група, 3-бром-1-гексинільна група, 4,4,6,6-тетрафтор-1-додецинільна група, 5,5-дихлор-2-метил-3-пентинільна група, або 4-хлор-1,1-диметил-2-бутинільна група, переважно C₂₋₆ галоалкінільна група, і т.і.

“C₃₋₈ циклоалкільна група” є алкільною групою, що має 3 - 8 атомів вуглецю в циклічному заміснику. Прикладами C₃₋₈ циклоалкільної групи є циклопропільна група, циклобутинільна група, циклопентинільна група, циклогексинільна група, циклогептинільна група, циклооктинільна група, і т.і. Серед них, C₃₋₆ циклоалкільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної C₃₋₈ циклоалкільної групи” є алкіл-заміщена циклоалкільна група, така як 2,3,3-триметилциклобутинільна група, 4,4,6,6-тетраметилциклогексинільна група, або 1,3-дибутилциклогексинільна група, переважно C₃₋₆ циклоалкільна група, в якій 1 - 3 C₁₋₆ алкільна група(и) є заміщеною(ими), і т.і.

“C₄₋₈ циклоалкенільна група” є алкенільною групою, що має 4 - 8 атомів вуглецю в циклічному заміснику. Прикладами C₄₋₈ циклоалкенільної групи є 1-циклобутенільна група, 1-циклопентенільна група, 3-циклопентенільна група, 1-циклогексенільна група, 3-циклогексенільна група, 3-циклогептенільна група, 4-циклооктенільна група, і т.і.

Прикладами “заміщеної C₄₋₈ циклоалкенільної групи” є алкіл-заміщена циклоалкенільна група, така як 2-метил-3-циклогексенільна група або 3,4-диметил-3-циклогексенільна група, переважно C₄₋₆ циклоалкенільна група, в якій 1 - 3 C₁₋₆ алкільна група(и) є заміщеною(ими), і т.і.

“C₆₋₁₀ арильна група” є моноциклічною або поліциклічною арильною групою, що має 6 - 10 атомів вуглецю. В поліциклічній арильній групі, якщо принаймні одне кільце є ароматичним кільцем, кільце(я), що залишилось, може бути будь-яким насиченим аліциклічним кільцем, ненасиченим аліциклічним кільцем і ароматичним кільцем. Прикладами C₆₋₁₀ арильної групи є фенільна група, нафтильна група, азуленільна група, інденільна група, інданільна група, тетралінільна група, і т.і. Серед них, фенільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної C₆₋₁₀ арильної групи” є алкіл-заміщена арильна група, така як 2-хлорфенільна група, 3,5-дихлорфенільна група, 4-фторфенільна група, 3,5-дифторфенільна група, 4-трифторметилфенільна група, або 2-метокси-1-нафтильна група, галогено-заміщена арильна група і алкокси-заміщена арильна група, переважно C₁₋₆ алкіл-заміщена C₆₋₁₀ арильна група, галогено-заміщена C₆₋₁₀ арильна група і C₁₋₆ алкокси заміщена арильна група.

“Гетероциклічна група” включає 1 - 4 гетероатом(и), що вибирають з групи, яка містить атом азоту, атом кисню і атом сірки, як складовий атом кільця. Гетероциклічна група може бути моноциклічною або поліциклічною.

Прикладами гетероциклічної групи є 5-членна гетероарильна група, 6-членна гетероарильна група, конденсована гетероарильна група, насичена гетероциклічна група, частково ненасичена гетероциклічна група і т.і.

5 Прикладами 5-членної гетероарильної групи є: піролільна група, така як пірол-1-ільна група, пірол-2-ільна група, або пірол-3-ільна група; фурильна група, така як фуран-2-ільна група або фуран-3-ільна група; тієнільна група, така як тіофен-2-ільна група, або тіофен-3-ільна група; імідазолільна група, така як імідазолільна-1-ільна група, імідазол-2-ільна група, імідазол-4-ільна група, або імідазол-5-ільна група; піразолільна група, така як піразол-1-ільна група, піразол-3-ільна група, піразол-4-ільна група, або піразол-5-ільна група; оксазолільна група, така як оксазол-2-ільна група, оксазол-4-ільна група, або оксазол-5-ільна група; ізоксазолільна група, така як ізоксазол-3-ільна група, ізоксазол-4-ільна група, або ізоксазол-5-ільна група; тіазолільна група, така як тіазол-2-ільна група, тіазол-4-ільна група, або тіазол-5-ільна група; ізотіазолільна група, така як ізотіазол-3-ільна група, ізотіазол-4-ільна група, або тіазол-5-ільна група; триазолільна група, така як 1,2,3-триазол-1-ільна група, 1,2,3-триазол-4-ільна група, 1,2,3-триазол-5-ільна група, 1,2,4-триазол-1-ільна група, 1,2,4-триазол-3-ільна група, або 1,2,4-триазол-5-ільна група; оксадіазолільна група, така як 1,2,4-оксадіазол-3-ільна група, 1,2,4-оксадіазол-5-ільна група, або 1,3,4-оксадіазол-2-ільна група; тіадіазоліл група, така як 1,2,4-тіадіазол-3-ільна група, 1,2,4-тіадіазол-5-ільна група, або 1,3,4-тіадіазол-2-ільна група; тетразолільна група, така як тетразол-1-ільна група або тетразол-2-ільна група; і т.і.

20 Прикладами 6-членної гетероарильної групи є: піридилна група, така як піридин-2-ільна група, піридин-3-ільна група, або піридин-4-ільна група; піразинільна група, така як піразин-2-ільна група або піразин-3-ільна група; піримідинільна група, така як піримідин-2-ільна група, піримідин-4-ільна група, або піримідин-5-ільна група; піридазинільна група, така як піридазин-3-ільна група або піридазин-4-ільна група; триазинільна група; і т.і.

25 Прикладами конденсованої гетероарильної групи є: індол-1-ільна група, індол-2-ільна група, індол-3-ільна група, індол-4-ільна група, індол-5-ільна група, індол-6-ільна група, індол-7-ільна група; бензофуран-2-ільна група, бензофуран-3-ільна група, бензофуран-4-ільна група, бензофуран-5-ільна група, бензофуран-6-ільна група, бензофуран-7-ільна група; бензотіофен-2-ільна група, бензотіофен-3-ільна група, бензотіофен-4-ільна група, бензотіофен-5-ільна група, бензотіофен-6-ільна група, бензотіофен-7-ільна група; бензоімідазол-1-ільна група, бензоімідазол-2-ільна група, бензоімідазол-4-ільна група, бензоімідазол-5-ільна група, бензоксазол-2-ільна група, бензоксазол-4-ільна група, бензоксазол-5-ільна група, бензотіазол-2-ільна група, бензотіазол-4-ільна група, бензотіазол-5-ільна група; хінолін-2-ільна група, хінолін-3-ільна група, хінолін-4-ільна група, хінолін-5-ільна група, хінолін-6-ільна група, хінолін-7-ільна група, хінолін-8-ільна група; і т.і.

35 Прикладами іншої гетероциклічної групи є: 3-членне насичене гетероциклічне кільце, таке як азиридин-1-ільна група, азиридин-2-ільна група, або оксиранільна група; 5-членне насичене гетероциклічне кільце, таке як піролідін-1-ільна група, піролідін-2-ільна група, піролідін-3-ільна група, тетрагідрофуран-2-ільна група, тетрагідрофуран-3-ільна група, або [1,3]діоксиран-2-ільна група; 6-членне насичене гетероциклічне кільце, таке як піперидин-1-ільна група, піперидин-2-ільна група, піперидин-3-ільна група, піперидин-4-ільна група, піперазин-1-ільна група, піперазин-2-ільна група, морфолін-2-ільна група, морфолін-3-ільна група, або морфолін-4-ільна група; 1,3-бензодіоксол-4-ільна група, 1,3-бензодіоксол-5-ільна група, 1,4-бензодіоксан-5-ільна група, 1,4-бензодіоксан-6-ільна група, 3,4-дигідро-2Н-1,5-бензодіоксепін-6-ільна група, 3,4-дигідро-2Н-1,5-бензодіоксепін-7-ільна група, 2,3-дигідробензофуран-4-ільна група, 2,3-дигідробензофуран-5-ільна група, 2,3-дигідробензофуран-6-ільна група, або 2,3-дигідробензофуран-7-ільна група; і т.і.

50 Прикладами “заміщеної гетероциклічної групи” є: 4-хлор-2-піридинільна група, 3-хлор-2-піразинільна група, 4-метил-2-піридинільна група, 5-трифторметил-2-піримідинільна група, 3-метил-2-хінолінільна група, і т.і.

“C₁₋₈ ацильною групою” є група, в якій атом водню, C₁₋₇ алкільної групи, C₂₋₇ алкенільної групи, C₂₋₇ алкінільної групи, C₆₋₇ арильної групи або 5-7-членної гетероциклічної групи є зв'язаним з карбонільною групою.

55 Прикладами C₁₋₈ ацильної групи є: формільна група; алкілкарбонільна група, така як ацетильна група, пропіонільна група, н-пропілкарбонільна група, н-бутилкарбонільна група, пентаноїльна група, валерильна група, октаноїльна група, і-пропілкарбонільна група, і-бутилкарбонільна група, півалоїльна група, або ізовалерильна група, переважно C₁₋₆ алкілкарбонільна група; алкенілкарбонільна група, така як акрилоїльна група, або метакрилоїльна група, переважно C₂₋₆ алкенілкарбонільна група; алкінілкарбонільна група, така як пропіолоїльна група, переважно C₂₋₆ алкінілкарбонільна група; арилкарбонільна група, така

як бензоїльна група; гетероциклічна карбонільна група, така як 2-піридилкарбонільна група або тіснількарбонільна група; і т.і.

Прикладами “заміщеної C_{1-8} ацильної групи” є: галоацильна група, така як монофторацетильна група, монохлорацетильна група, монобромацетильна група, дифторацетильна група, дихлорацетильна група, дибромацетильна група, трифторацетильна група, трихлорацетильна група, трибромацетильна група, 3,3,3-трифторпропіонільна група, 3,3,3-трихлорпропіонільна група, або 2,2,3,3,3-пентафторпропіонільна група, переважно C_{1-7} галоацильна група; і т.і.

“(1-іміно) C_{1-8} алкільна група” є імінометильною групою або групою, в якій C_{1-7} алкільна група зв'язана з імінометильною групою. Прикладами (1-іміно) C_{1-8} алкільної групи є імінометильна група, (1-іміно)етильна група, (1-іміно)пропільна група, (1-іміно)бутильна група, (1-іміно)пентильна група, (1-іміно)гексильна група, (1-іміно)гептильна група і т.і. Серед них, (1-іміно) C_{1-6} алкільна група є переважною.

Прикладами “заміщеної (1-іміно) C_{1-8} алкільної групи” є: (1-гідроксиіміно)алкільна група, така як гідроксиімінометильна група, (1-гідроксиіміно)етильна група, (1-гідроксиіміно)пропільна група, або (1-гідроксиіміно)бутильна група, переважно (1-гідроксиіміно) C_{1-6} алкільна група; (1-алкоксиіміно)алкільна група, така як метоксиімінометильна група, (1-етоксиіміно)метильна група, (1-метоксиіміно)етильна група, (1-т-бутоксиіміно)етильна група, або (1-етоксиіміно)етильна група, переважно (1-(C_{1-6} алкокси)іміно) C_{1-6} алкільна група; і т.і.

“Заміщена карбоксильна група” є групою, в якій C_{1-6} алкільна група, C_{2-6} алкенільна група, C_{2-6} алкінільна група, C_{6-10} арильна група, C_{6-10} арил C_{1-6} алкільна група або 5-6-членна гетероциклічна група зв'язана з карбонільною групою.

Прикладами “заміщеної карбоксильної групи” є: алкоксикарбонільна група, така як метоксикарбонільна група, етоксикарбонільна група, н-пропоксикарбонільна група, і-пропоксикарбонільна група, н-бутоксикарбонільна група, і-бутоксикарбонільна група, т-бутоксикарбонільна група, н-пентилоксикарбонільна група або н-гексилоксикарбонільна група, переважно C_{1-6} алкоксикарбонільна група;

алкенілоксикарбонільна група, така як вінілоксикарбонільна група або алілоксикарбонільна група, переважно C_{2-6} алкенілоксикарбонільна група;

алкінілоксикарбонільна група, така як етинілоксикарбонільна група або пропаргілоксикарбонільна група, переважно C_{2-6} алкінілоксикарбонільна група;

арилоксикарбонільна група, така як феноксикарбонільна група або нафтоксикарбонільна група, переважно C_{6-10} арилоксикарбонільна група;

аралкілоксикарбонільна група, така як бензилоксикарбонільна група, переважно C_{6-10} арил C_{1-6} алкоксикарбонільна група; і т.і.

“Заміщена карбамоїльна група” є групою, в якій C_{1-6} алкільна група, C_{2-6} алкенільна група, C_{2-6} алкінільна група, C_{6-10} арильна група, C_{6-10} арил C_{1-6} алкільна група або 5-6-членна гетероциклічна група зв'язана з карбамоїльною групою.

Прикладами “заміщеної карбамоїльної групи” є: моноалкілкарбамоїльна група або діалкілкарбамоїльна група, така як метилкарбамоїльна група, етилкарбамоїльна група, диметилкарбамоїльна група, або діетилкарбамоїльна група, переважно моно C_{1-6} алкілкарбамоїльна група або ди C_{1-6} алкілкарбамоїльна група; моноарилкарбамоїльна група, така як фенілкарбамоїльна груп або 4-метилфенілкарбамоїльна група, переважно моно C_{6-10} арилкарбамоїльна група; і т.і.

Прикладами “заміщеної гідроксильної групи” є: алкокси група, така як метокси група, етокси група, н-пропокси група, н-бутокси група, н-пентилокси група, н-гексилокси група, децилокси група, дедедилокси група, лаурилокси група, і-пропокси група, і-бутокси група, в-бутокси група, т-бутокси група, 1-етилпропокси група, і-гексилокси група, 4-метилпентокси група, 3-метилпентокси група, 2-метилпентокси група, 1-метилпентокси група, 3,3-диметилбутокси група, 2,2-диметилбутокси група, 1,1-диметилбутокси група, 1,2-диметилбутокси група, 1,3-диметилбутокси група, 2,3-диметилбутокси група, 1-етилбутокси група, або 2-етилбутокси група, переважно C_{1-6} алкокси група;

циклоалкілалкокси група, така як циклопропілметилокси група або 2-циклопентилетилокси група, переважно C_{3-8} циклоалкіл C_{1-6} алкокси група; аралкілокси група, така як бензилокси група, переважно C_{6-10} арил C_{1-6} алкокси група; галоалкокси група, така як хлорметокси група, дихлорметокси група, трихлорметокси група, трифторметокси група, 1-фторетокси група, 1,1-дифторетокси група, 2,2,2-трифторетокси група, або пентафторетокси група, переважно C_{1-6} галоалкокси група; алкенілокси група, така як вінілокси група, 1-пропенілокси група, алілокси група, 1-бутенілокси група, 2-бутенілокси група, 3-бутенілокси група, 1-пентенілокси група, 2-пентенілокси група, 3-пентенілокси група, 4-пентенілокси група, 1-гексенілокси група, 2-

гексенілокси група, 3-гексенілокси група, 4-гексенілокси група, 5-гексенілокси група, 1-метил-2-пропенілокси група, 2-метил-2-пропенілокси група, 1-метил-2-бутенілокси група, або 2-метил-2-бутенілокси група, переважно C_{2-6} алкенілокси група;

5 алкінілокси група, така як етинілокси група, пропінілокси група, пропаргілокси група, 1-бутинілокси група, 2-бутинілокси група, 3-бутинілокси група, 1-пентинілокси група, 2-пентинілокси група, 3-пентинілокси група, 4-пентинілокси група, 1-гексинілокси група, 1-метил-2-пропінілокси група, 2-метил-3-бутинілокси група, 1-метил-2-бутинілокси група, 2-метил-3-пентинілокси група, або 1,1-диметил-2-бутинілокси група, переважно C_{2-6} алкінілокси група; циклоалкілокси група, така як циклопропілокси група, циклобутилокси група, циклопентилокси група, циклогексилокси група, циклогептилокси група, циклооктилокси група, 2-метилциклопропілокси група, 2-етилциклопропілокси група, 2,3,3-триметилциклобутилокси група, 2-метилциклопентилокси група, 2-етилциклогексилокси група, 2-етилциклооктилокси група, 4,4,6,6-тетраметилциклогексилокси група, або 1,3-дибутилциклогексилокси група, переважно C_{3-6} циклоалкілокси група; арилокси група, така як фенілокси група, нафтилокси група, азуленілокси група, інденілокси група, інданілокси група, або тетралінілокси група, переважно C_{6-10} арилокси група;

арилалкілокси група (аралкілокси група), така як бензилокси група, фенетилокси група, або 2-нафтилметилокси група, переважно C_{6-10} арил C_{1-6} алкілокси група;

20 ацилокси група, така як ацетилокси група, пропіонілокси група, н-пропілкарбонілокси група, і-пропілкарбонілокси група, н-бутилкарбонілокси група, і-бутилкарбонілокси група, пентаноїлокси група, або півалоїлокси група, переважно C_{1-7} ацилокси група;

алкоксикарбоніалкілокси група, така як метоксикарбонілметилокси група або 1-метоксикарбоніл-1-метилетилокси група, переважно C_{1-6} алкоксикарбоніл C_{1-6} алкокси група;

25 триалкілсилілокси група, така як триметилсилілокси група або т-бутилдиметилсилілокси група, переважно три C_{1-6} алкілсилілокси група;

і т.і.

Прикладами “заміщеної аміногрупи” є: алкіламіногрупа, така як метиламіногрупа, етиламіногрупа, н-пропіламіногрупа, н-бутиламіногрупа, диметиламіногрупа, або діетиламіногрупа, переважно моно C_{1-6} алкіламіногрупа або ди C_{1-6} алкіламіногруп; моно C_{1-6} алкіліденаміногрупа, така як метиліденаміногрупа, або етиліденаміногрупа; моноариламіногрупа, така як феніламіногрупа або 4-метилфеніламіногрупа, переважно моно C_{6-10} ариламіногрупа; діариламіногрупа, така як ди-1-нафтиламіногрупа, переважно ди C_{6-10} ариламіногрупа; аралкіламіногрупа, така як бензиламіногрупа, переважно C_{6-10} арил C_{1-6} алкіламіногрупа; ациламіногрупа, така як ацетиламіногрупа, трифторацетиламіногрупа, або бензоїламіногрупа, переважно C_{1-6} ациламіногрупа; алкоксикарбоніламіногрупа, така як метоксикарбоніламіногрупа або т-бутоксикарбоніламіногрупа, переважно C_{1-6} алкоксикарбоніламіногрупа; і т.і.

40 Прикладами “заміщеної меркапто групи” є: алкілтіо група, така як метилтіо група або етилтіо група, переважно C_{1-6} алкілтіо група; арилтіо група, така як фенілтіо група або 4-метилфенілтіо група, переважно C_{6-10} арилтіо група; ацилтіо група, така як ацетилтіо група або бензоїлтіо група, переважно C_{1-6} ацилтіо група; і т.і.

45 Прикладами “заміщеної сульфонільної групи” є: алкілсульфонільна група, така як метилсульфонільна група, етилсульфонільна група, н-пропілсульфонільна група, і-пропілсульфонільна група, н-бутилсульфонільна група, і-бутилсульфонільна група, в-бутилсульфонільна група, т-бутилсульфонільна група, н-пентилсульфонільна група, і-пентилсульфонільна група, неопентилсульфонільна група, 1-етилпропілсульфонільна група, н-гексилсульфонільна група, або і-гексилсульфонільна група, переважно C_{1-6} алкілсульфонільна група; галоалкілсульфонільна група, така як трифторметилсульфонільна група, переважно C_{1-6} галоалкілсульфонільна група; арилсульфонільна група, така як фенілсульфонільна група або 4-метилфенілсульфонільна група, переважно C_{6-10} арилсульфонільна група; сульфогрупа; алкоксисульфонільна група, така як метоксисульфонільна група або етоксисульфонільна група, переважно C_{1-6} алкоксисульфонільна група; сульфамойльна група; сульфамойльна група, така як N-метилсульфамойльна група, N-етилсульфамойльна група, N,N-диметилсульфамойльна група, або N,N-діетилсульфамойльна група, переважно моно C_{1-6} алкілсульфамойльна група або ди C_{1-6} алкілсульфамойльна група; моноарилсульфамойльна група, така як фенілсульфамойльна група або 4-метилсульфамойльна група, переважно моно C_{6-10} арилсульфамойльна група; і т.і.

Прикладами “галогену” є атом фтору, атом хлору, атом бром, атом йоду, і т.і.

Як переважну комбінацію групи представленої $CR^1R^2R^3$, можна згадати наступну комбінацію. R^1 представляє незаміщену або заміщену гідроксильну групу;

60 R^2 представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу; і

R^3 представляє атом водню, незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} алкоксикарбонільну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу або ціаногрупу.

Наступну комбінацію також можна включити як переважний приклад.

R^1 представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу;

R^2 представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу; і

R^3 представляє заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} алкоксикарбонільну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену сульфонільну групу або ціаногрупу.

R^1 і R^2 можуть бути зв'язані, утворюючи незаміщене або заміщене 5-8-членне кільце або утворюючи $O=$, $R^aR^bC=$ або $R^cN=$.

Тут, R^a представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу. R^b представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу. R^c представляє незаміщену або заміщену гідроксильну групу або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу.

Незаміщена або заміщена C_{1-8} алкільна група в R^a , R^b і R^c можуть бути таким ж самими як " C_{1-8} алкільна група" згадана як приклади в R^1 - R^3 вище.

Заміщена гідроксильна група в R^c може бути такою ж самою як "заміщена гідроксильна група" згадана як приклади в R^1 - R^3 вище.

Прикладами незаміщеного або заміщеного 5-8-членного кільця, яке може утворюватись з R^1 і R^2 зв'язаних разом, є: аліфатичне вуглеводневе кільце, таке як циклопропанове кільце, циклобутанове кільце, циклопентанове кільце, циклогексанове кільце, циклогептанове кільце або циклооктанове кільце, переважно C_{3-8} циклоалканове кільце; ненасичене гетероциклічне кільце, таке як оксиранове кільце, [1,3]діоксиранове кільце, дигідро-2Н-піранове кільце, дигідро-2Н-тіопіранове кільце і тетрагідропіридинове кільце, переважно кисне-вмісне 3-5-членне ненасичене гетероциклічне кільце.

Незаміщена або заміщена C_{6-10} арильна група в R може бути такою ж самою як " C_{6-10} арильна група" згадана як приклади в R^1 - R^3 вище. Вона переважно є фенільною групою.

$[R^4]$

R^4 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщену сульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

Групи представлені R^4 можуть бути такими ж самими як приклади приведені в групах представлених R^1 - R^3 .

У Формулах (I), (II) і (III), m і $m1$ представляє кількість R^4 і є цілим числом від 0 до 6.

R^4 переважно представляє C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} галоалкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, гідроксильну групу, C_{1-6} алкоксигрупу або галоген.

$[R^5]$

R^5 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену або заміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену або заміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену або заміщену гетероциклічну групу, незаміщену або заміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену або заміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, незаміщену або заміщену меркаптогрупу, заміщений сульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

Групи представлені R^5 можуть бути такими ж самими як приклади приведені в групах представлених R^1 - R^3 .

У Формулах (I) і (II), n представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 5. У Формулі (III), n_1 представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 4.

5 R^5 переважно представляє C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} галоалкільну групу, C_{6-10} арил C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{6-10} арильну групу, C_{1-7} ацильну групу, C_{1-6} алкоксикарбонільна група, C_{1-6} алкокси група, аміногрупу, моно C_{1-6} алкіламіногрупу, ди C_{1-6} алкіламіногрупу, C_{1-6} алкоксикарбоніламіногрупу, C_{1-6} алкілтіогрупу, C_{1-6} алкілсульфонільну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

Будь-який один з $R^1 - R^3$ і будь-який один з R^5 , зв'язані разом, можуть утворювати незаміщене або заміщене 5-8-членне кільце.

10 Прикладами 5-8-членного кільця є: ароматичне вуглеводневе кільце, таке як бензольне кільце; C_{5-8} циклоалкенове кільце, таке як цикlopентенове кільце, цикlopентадієнове кільце, циклогексенове кільце, циклогептенове кільце або циклооктенове кільце і т.і.

[A, D]

15 Коли R є групою представленою $CR^1R^2R^3$, A представляє 5-7-членне вуглеводневе кільце або 5-7-членне гетероциклічне кільце.

20 Прикладами 5-7-членного вуглеводневого кільця є: ароматичне вуглеводневе кільце, таке як бензольне кільце; C_{5-7} циклоалкенове кільце, таке як цикlopентенове кільце, циклогексенове кільце, циклогептенове кільце; ароматичне 5-7-членне гетероциклічне кільце, таке як фуранове кільце, тіофенове кільце, пірольне кільце, імідазольне кільце, піразольне кільце, тіазольне кільце, оксазольне кільце, ізоксазольне кільце, піридинове кільце, піразинове кільце, піримідинове кільце, піридазинове кільце, азепінове кільце або діазепінове кільце; ненасичене 5-7-членне гетероциклічне кільце, таке як дигідро-2H-піранове кільце, дигідро-2H-тіопіранове кільце або тетрагідропіридинове кільце; і т.і. Серед них, ароматичне вуглеводневе кільце є переважним і бензольне кільце є більш переважним.

25 Коли R є незаміщена або заміщена C_{6-10} арильна група або ціаногрупа, A представляє бензольне кільце.

Тобто, переважно, що сполука згідно з представленим винаходом є сполукою (II) або (III).

D представляє 5-7-членне вуглеводневе кільце або 5-7-членне гетероциклічне кільце.

30 Прикладами 5-7-членного вуглеводневого кільця і 5-7-членного гетероциклічного кільця є такі ж самі як приклади приведені вище як A, і серед них, ароматичне вуглеводневе кільце є переважним і бензольне кільце є більш переважним.

Тобто, більш переважно, що сполука згідно з представленим винаходом є сполукою (III).

[X, Y, Z]

35 X представляє атом кисню, атом сірки, сульфенільну групу, сульфонільну групу, незаміщений або заміщений атом вуглецю або незаміщений або заміщений атом азоту.

Прикладами замісника атома вуглецю є оксогрупа, C_{2-6} алкеніламіногрупа і гідроксильна група.

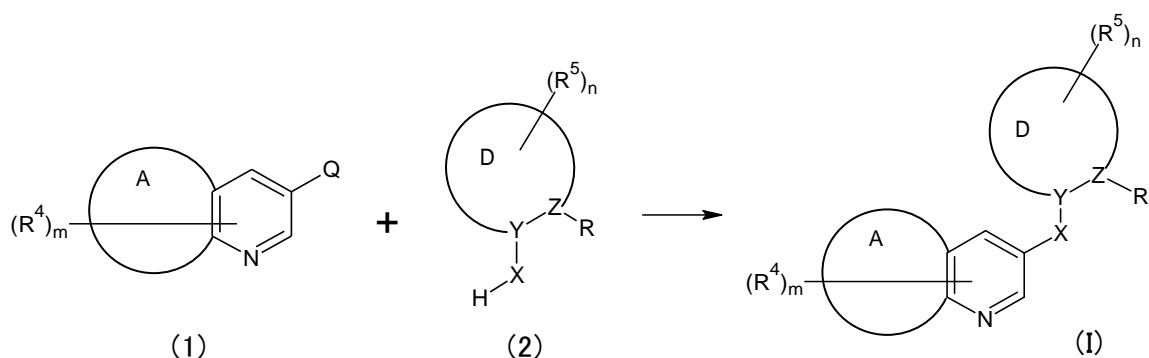
Y представляє атом вуглецю або атом азоту. Z представляє атом вуглецю або атом азоту. Переважно, що Y і Z обидва є атомами вуглецю, і D є ароматичним кільцем, яке включає Y, і Z.

40 Сіль або N-оксид сполуки згідно з представленим винаходом спеціально не обмежується, доки вона є сільськогосподарсько прийнятною сіллю або N-оксидом сполуки. Прикладами солі є: сіль неорганічної кислоти, такої як хлор воднева кислота або сірчана кислота; сіль органічної кислоти, такої як оцтова кислота або молочна кислота; сіль лужного металу, такого як літій, натрій або калій; сіль лужноземельного металу, такого як кальцій або магній; сіль перехідного металу, такого як залізо або мідь; сіль органічної основи, такої як аміак, триетиламін, трибутиламін, піридин або гідразин; і т.і.

(Одержання сполуки згідно з представленим винаходом)

Сполуку згідно з представленим винаходом можна одержати згідно з наступними способами синтезу.

50 (Спосіб синтезу 1)

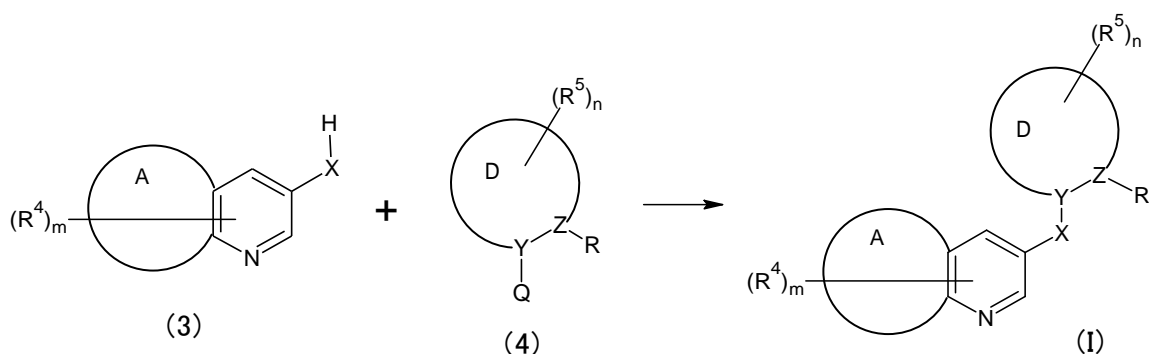


(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище. Q представляє атом галогену.)

5 Сполуку представлену Формулою (I) можна одержати реакцією сполуки представлені Формулою (1) і сполуки представлені Формулою (2) за допомогою звичайних методик.

Згідно з представленим винаходом, 7,8-дифтор-3-йод-хінолін є корисною проміжною сполукою.

(Спосіб синтезу 2)

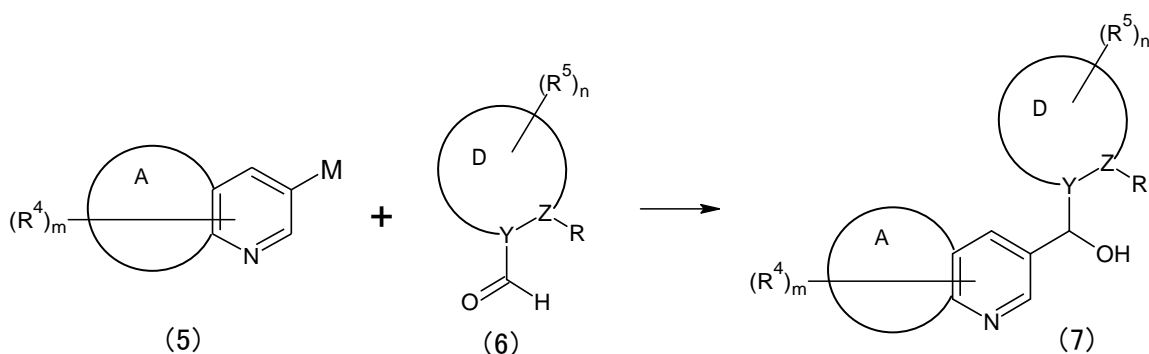


(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, Q, X, Y, Z, m і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище).

15 Сполуку представлену Формулою (I) можна одержати реакцією сполуки представлені Формулою (3) і сполуки представлені Формулою (4) за допомогою звичайних методик.

Згідно з представленим винаходом, 8-фтор-3-гідроксихінолін, 7,8-дифтор-3-гідроксихінолін, 8-фтор-3-гідрокси-2-метилхінолін, або 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхінолін є корисною проміжною сполукою.

(Спосіб синтезу 3)



(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище. M представляє літій або магній).

25 Сполуку представлену Формулою (5) одержують лініюванням або утворенням комплексу магнію, використовуючи алкіллітійовий реагент або реагент Грін'яра або готовий комплекс

одержаний з алкіллітієвого реагенту або реагенту Грін'яра, і потім до нього додають сполуку представлену Формулою (6), одержуючи сполуку представлену Формулою (7).

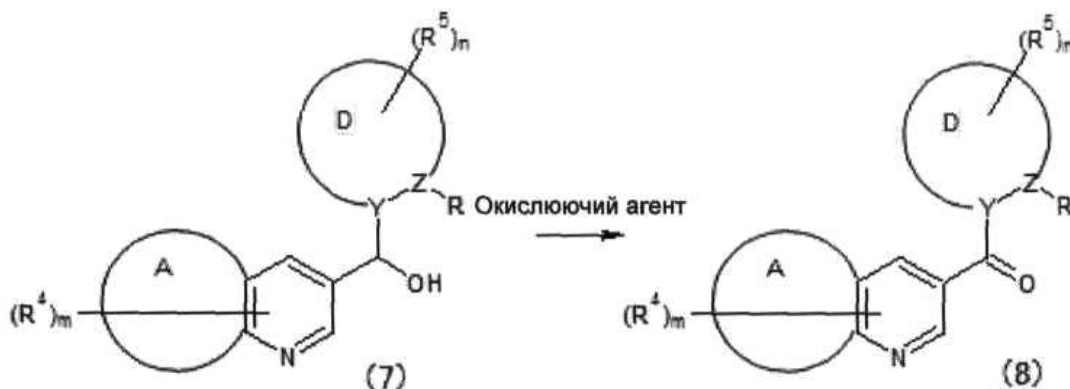
Прикладами алкіллітієвого реагенту використововуваного при літіюванні є метиллітій, н-бутиллітій, в-бутиллітій, т-бутиллітій і т.і.

5 Прикладами використововуваного реагенту Грін'яра при утворенні комплексу магнію є метилмагнійхлорид, етилмагнійхлорид, н-бутилмагнійхлорид, і-пропілмагнійхлорид і т.і. Також, наприклад, при одержанні готового комплексу використовують н-бутилмагнійхлорид і н-бутиллітій.

10 Розчинник використовуваний при літіюванні або утворенні магнієвого комплексу спеціально не обмежується, доки він утворює безводну реакційну систему без розчинення сполуки до реакції або проявляє будь-яку певну взаємодію між ними. Його придатними прикладами є: алкановий розчинник, такий як пентан, гексан, гептан, ISOPAR (зареєстрована торгова марка) Е або ISOPAR (зареєстрована торгова марка) G; ароматичний розчинник, такий як бензол, толуол або орто-ксилен; етерний розчинник, такий як діетиловий етер або тетрагідрофуран; і їх суміш.

15 Серед них, переважним є етерний розчинник, такий як діетиловий етер або тетрагідрофуран. Реакцію можна проводити в атмосфері азоту і безводній системі і при температурі від -10°C до -78°C .

(Спосіб синтезу 4)

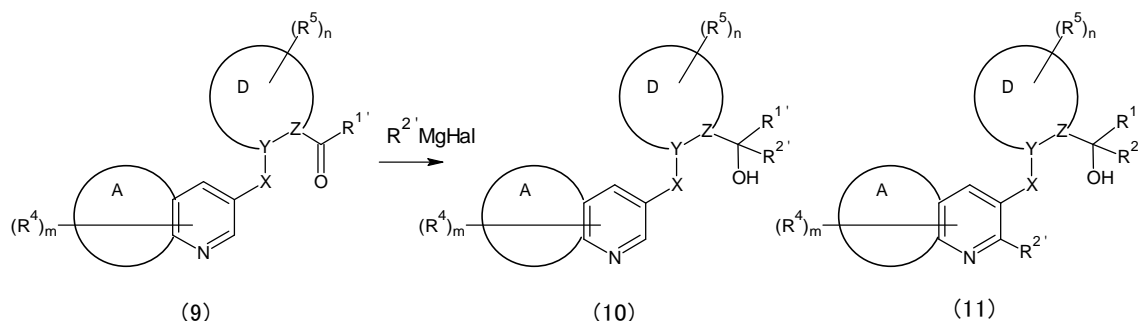


20

(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, Y, Z, m і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище).

Сполуку представлену Формулою (8) одержують окисленням за допомогою реакції окислюючого агента із сполукою представлену Формулою (7). Згадану вище реакцію окислення проводять без спеціального обмеження, доки реакція окислює вторинну гідроксильну групу. Наприклад, може бути адаптований спосіб окислення, таке як окислення Джонса, окислення озоном або окислення Сверна, або використовуючи окислювальні реагенти, такі як діоксид магнію або реагент Деса-Мартіна.

(Спосіб синтезу 5)

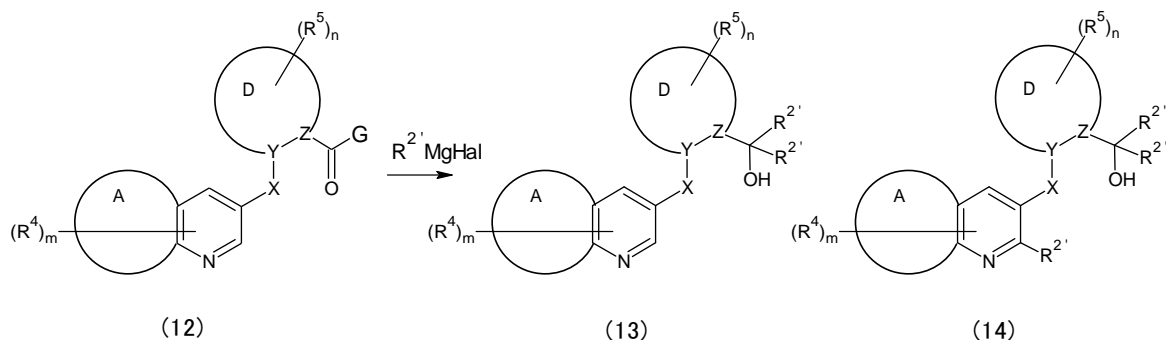


30

35 (У формулах, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище. R¹ і R², серед згаданих вище R¹ - R³, представляє незаміщену або заміщену алкілну групу, незаміщену або заміщену алкенільну групу, незаміщену або заміщену алкінільну групу, незаміщену або заміщену арильну групу або незаміщене або заміщене гетероциклічне кільце. Hal представляє атом галогену).

Сполуку представлену Формулою (10) можна одержати реакцією еквіваленту реагент Грін'яра з сполукою представлену Формулою (9). Також, сполуку представлену Формулою (11) можна одержати реакцією, принаймні, двох еквівалентів реагенту Грін'яра з сполукою представлену Формулою (9).

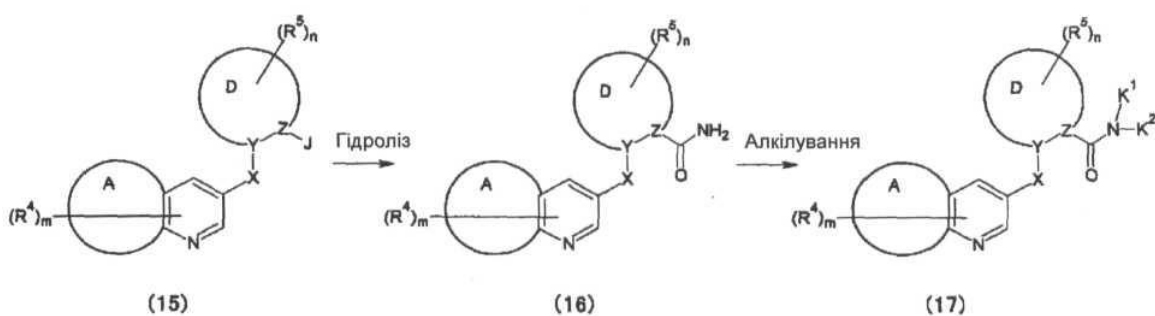
5 (Спосіб синтезу 6)



10 (У формулах, R^4 , R^5 , $R^{2'}$, A, D, X, Y, Z, m, n і Hal мають такі ж самі значення як ті що описані вище. G представляє групу, що відходить, таку як алкоксигрупа або атом галогену).

Сполуку представлену Формулою (13) можна одержати реакцією одного еквіваленту реагенту Грін'яра з сполукою представлену Формулою (12). Також, сполуку представлену Формулою (14) можна одержати реакцією, принаймні, двох еквівалентів реагенту Грін'яра з сполукою представлену Формулою (12).

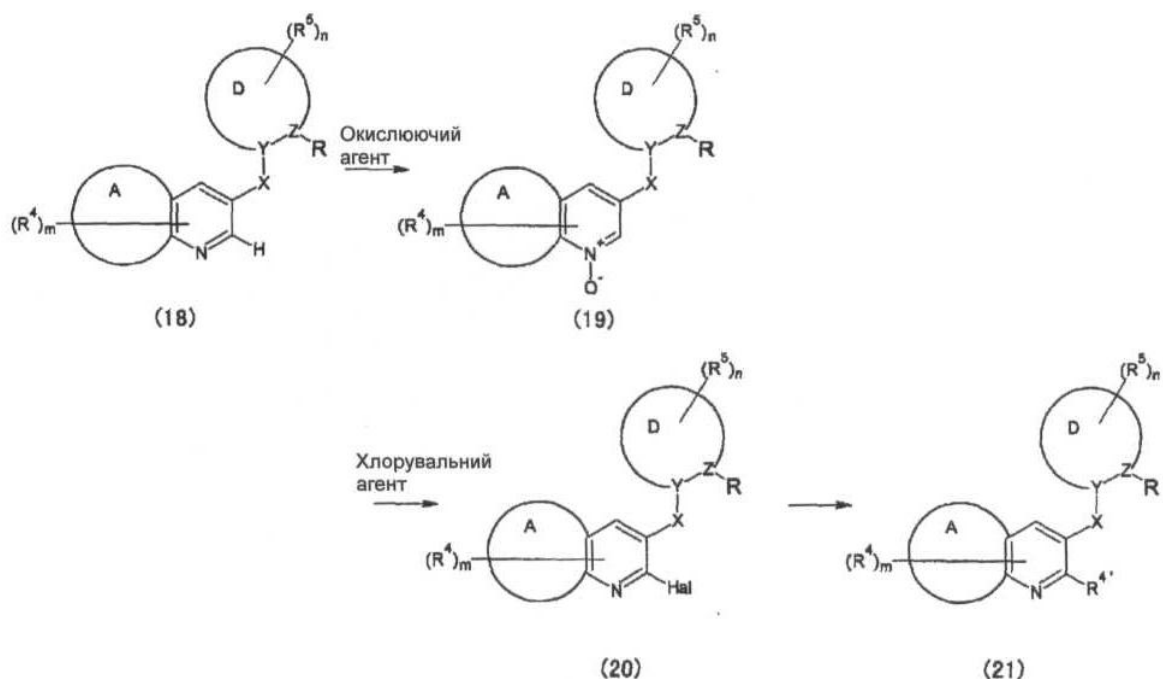
15 (Спосіб синтезу 7)



20 (У формулах, R^4 , R^5 , A, D, X, Y, Z, m, і n мають такі ж самі значення як ті що описані вище. J представляє алкоксикарбонільну групу або ціаногрупу. K^1 і K^2 представляє алکیلну групу).

Сполуку представлену Формулою (16) можна одержати гідролізом використовуючи звичайні методики. Також, сполуку представлену Формулою (17) можна одержати реакцією з алкілювальним агентом в присутності основи.

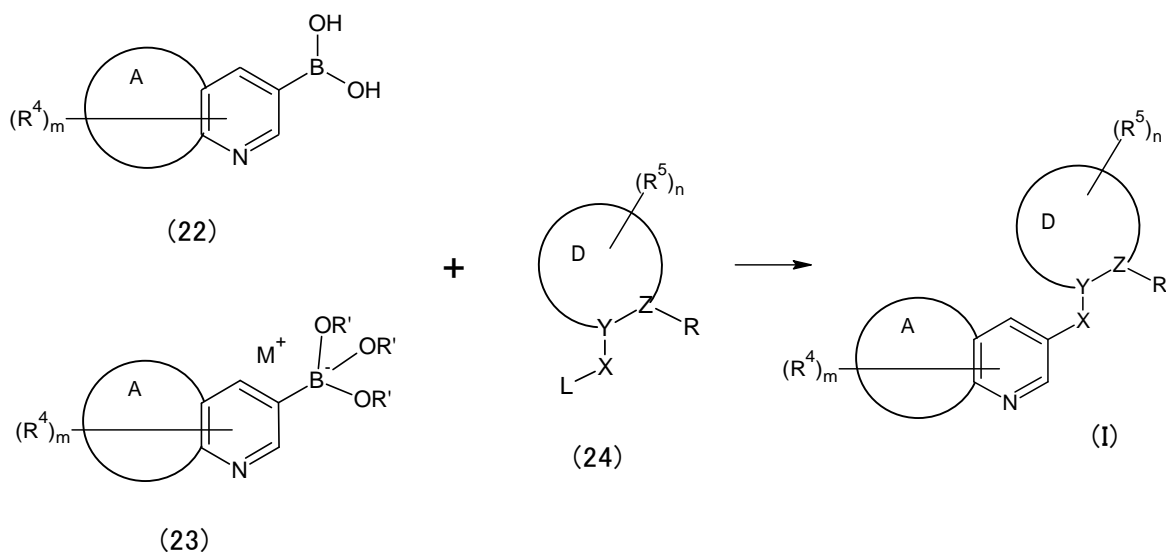
25 (Спосіб синтезу 8)



(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m, n і Hal мають такі ж самі значення як ті що описані вище. R⁴ представляє незаміщену або заміщену алкоксигрупу, незаміщену або заміщену алкільну групу, незаміщену або заміщену алкенільну групу, незаміщену або заміщену алкінільну групу, незаміщену або заміщену арильну групу, або незаміщене або заміщене гетероциклічна кільце, незаміщену або заміщену аміногрупу або незаміщену або заміщену тіоалкільну групу).

N-оксид сполуки представленої Формулою (19) можна одержати окисленням сполуки представленої Формулою (18) використовуючи звичайні способи, такі як використовуючи окислюючий агент. Сполуку представлену Формулою (20) можна одержати реакцією звичайного галогенувального агента, такого як оксихлорид фосфору, з сполукою представленою Формулою (19). І потім, сполуку представлену Формулою (20) піддають реакції нуклеофільного заміщення або реакції конденсації, використовуючи органометалевий каталізатор, одержуючи сполуку представлену Формулою (21).

(Спосіб синтезу 9)



(У формулах, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m, n і p мають такі ж самі значення як ті що описані вище. R' представляє C₁₋₈ алкільну групу. M представляє лужний метал, такий як літій, натрій, або калій. L представляє атом галогену.

Сполуку представлену Формулою (I) можна одержати конденсуванням Сузукі похідного борної кислоти представленого Формулою (22) або Формулою (23) і галоїдного похідного представленого Формулою (24).

5 N-оксид сполуки можна одержати за допомогою звичайної реакції окислення. Наприклад, в розчиннику або у відсутності розчинників, його можна одержати шляхом контактування сполуки представленної Формулою (I) і пероксиду, такого як пероксид водню.

В будь-якій реакції, після завершення реакції, одержаний продукт піддають нормальній післяреакційній обробці, що використовується в органічній синтетичній хімії, після чого піддають звичайному розділенню і очищенню, якщо необхідно, ефективно виділяючи бажаний продукт.

10 Структуру бажаного продукту можна визначити і підтвердити за допомогою ¹H-ЯМР спектру, ІЧ спектру або маспектрометрії або використовуючи елементний аналіз або т.і.

2) Сільськогосподарський фунгіцид

15 Сільськогосподарський фунгіцид згідно з представленим винаходом містить, як її активний інгредієнт, принаймні, один інгредієнт, що вибирають з групи, що містить азотвмісну гетероциклічну сполуку, її сіль і N-оксид сполуки.

Фунгіцид згідно з представленим винаходом має відмінну фунгіцидну активність щодо широкого переліку міцеліальних грибів, таких як бактерії, що належать до Ооміцетів, Аскоміцетів, Дейтеромицетів або Базидіоміцетів.

20 Фунгіцид згідно з представленим винаходом може використовуватись для попередження різних захворювань, що мають місце при вирощуванні сільськогосподарських культур, включаючи квіти, торф і трава, шляхом обробки насіння, обприскування листя, обробки ґрунту або занурення.

Наприклад, він може бути використаний для попередження:

25 цукровий буряк: плямистість листя (*Cercospora beticola*), чорна коренева гниль (*Aphanomyces cohlloides*), коренева гниль (*Thanatephorus cucumeris*), гниття листя (*Thanatephorus cucumeris*);

арахіс: коричнева плямистість листя (*Mycosphaerella arachidis*), чорна іржа (*Mycosphaerella berkeleyi*);

30 огірок: Справжня борошниста роса (*Sphaerotheca fuliginea*), Несправжня борошниста роса (*Pseudoperonospora cubensis*), Чорна мікросферельозна гниль гарбузових (*Mycosphaerella melonis*), В'янення (*Fusarium oxysporum*), Склеротиноз коріння (*Sclerotinia sclerotiorum*), Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Антракноз (*Colletotrichum orbiculare*), Парша (*Cladosporium cucumerinum*), Цільова плямистість листя (*Corynespora cassicola*), Ризоктиніоз (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani* Kuhn), Бактеріальна плямистість (*Pseudomonas syringae* pv. *Lecrymans*);

35 томат: Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Пліснява на листі (*Cladosporium fulvum*), Фітофторова коренева гниль (*Phytophthora infestans*);

баклажан: Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Чорна гниль (*Corynespora melongenae*), Справжня борошниста роса (*Erysiphe cichoracearum*), Пліснявий наліт (*Mycovellosiella nattrassii*);

40 полуниця: Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Справжня борошниста роса (*Sphaerotheca humuli*), Антракноз (*Colletotrichum acutatum*, *Colletotrichum fragariae*), Фітофторова коренева гниль (*Phytophthora cactorum*);

цибуля: Ціпа гниль шийки коріння (*Botrytis allii*), Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Плямистість листя (*Botrytis squamosa*), Несправжня борошниста роса (*Peronospora destructor*);

45 капуста: Кіла хрестоцвітих (*Plasmodiophora brassicae*), Пліснява гниль (*Erwinia carotovora*), Несправжня борошниста роса (*Peronospora parasitica*);

квасоля: Склеротиноз коріння (*Sclerotinia sclerotiorum*), Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*);

50 яблуко: Справжня борошниста роса (*Podosphaera leucotricha*), Парша (*Venturia inaequalis*), Моніліоз (*Monilinia mali*), Фруктові плями Брукса (*Mycosphaerella pomii*), коричневий некроз (*Valsa mali*), Альтернаріозна плямистість (*Alternaria mali*), Іржа яблунь і груш (*Gymnosporangium yamadae*), Біла гниль (*Botryosphaeria berengeriana*), Антракноз (*Glomerella cingulata*, *Collectotrichum acutatum*), Марссоніозна плямистість (*Diplocarpon mali*), Мухосед яблук (*Zygophiala jamaicensis*), сажиста плямистість (*Gloeodes pomigena*);

хурма: Справжня борошниста роса (*Phyllactinia kakkicola*), Антракноз (*Gloeosporium kaki*), Ангулярна плямистість листя (*Cercospora kaki*);

55 персик: Бура гниль (*Monilinia fructicola*), Парша (*Cladosporium carpophilum*), Фомопсисна бактеріальна гниль (*Phomopsis* sp.);

вишня: Бура гниль (*Monilinia fructicola*);

виноград: Ціпа гниль (*Botrytis cinerea*), Справжня борошниста роса (*Uncinula necator*), Гломерельозна гниль (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*), Несправжня борошниста

роса (*Plasmopara viticola*), Первоцвіт мучнистий коріння (*Elsinoe ampelina*), Плямистість листя (*Pseudocercospora vitis*), Чорна гниль (*Guignardia bidwellii*);

груша: Парша (*Venturia nashicola*), Іржа яблунь і груш (*Gymnosporangium asiaticum*), Плямистість листя (*Alternaria kikuchiana*), Чорна гниль (*Botryosphaeria berenengeriana*),

5 Справжня борошниста роса (*Phyllactinia mali*);

чай: Гниль гілок (*Pestalotia theae*), Антракноз (*Colletotrichum theae-sinensis*);

цитрус: Парша (*Elsinoe fawcetti*), Блакитна пліснява (*Penicillium italicum*), Зелена пліснява (*Penicillium digitatum*), Сіра гниль (*Botrytis cinerea*), Меланоз (*Diaporthe citri*), Бактеріальний рак (*Xanthomonas campestris* pv. Citri);

10 пшениця: Справжня борошниста роса (*Erysiphe graminis* f.sp. tritici), Петч (*Gibberella zeae*), Листова іржа (*Rustia recondita*), Коричнево-сніжна пліснява (*Pythium iwayamai*), червоно-сніжна пліснява (*Monographella nivalis*), Чорнаглазна плямистість (*Pseudocercospora herpotrichoides*), Плямистість листя (*Septoria tritici*), септоріоз колоскової луски пшениці (*Leptosphaeria nodorum*), Сніжний тифулоз (*Typhula incarnata*), Сніжна склеротинія (*Myriosclerotinia borealis*), Випрівання

15 (*Gaeumannomyces graminis*);

ячмінь: Смогастість листя (*Pyrenophora graminis*), ринхоспоріоз листя (*Rhynchosporium secalis*), Пильна головня ячменю (*Ustilago tritici*, *U. nuda*);

рис: Шийкова гниль (*Pyricularia oryzae*), ризоктоніоз стебел і в'ягалищ рису (*Rhizoctonia solani*), Фузаріоз рису (*Gibberella fujikuroi*), Гельмінтоспорій (*Cochliobolus niyabeanus*), Ризоктиніоз (*Pythium graminicolum*), Бактеріальний некроз (*Xanthomonas oryzae*), Бактеріальний ризоктиніоз (*Burkholderia plantarii*), Бура лінійна іржа листя (*Acidovorax avenae*), Бактеріальна гниль зерна (*Burkholderia glumae*);

20 тютюн: Склеротиніоз коріння (*Sclerotinia sclerotiorum*), Справжня борошниста роса (*Erysiphe cichoracearum*);

25 тюльпан: Сіра гниль (*Botrytis cinerea*);

жорстковолосисті трави: Сніжна склеротинія (*Sclerotinia borealis*), Бура плямистість (*Pythium asphanidermatum*);

ежа збірна: Справжня борошниста роса (*Erysiphe graminis*);

30 соя: Пурпурова плямистість (*Cercospora kikuchii*), Несправжня борошниста роса (*Peronospora manshurica*), Стволова гниль (*Phytophthora sojae*);

картопля · томат: Фітофторова коренева гниль (*phytophthora infestans*);

або т.і.

Також, фунгіцид згідно з представленим винаходом проявляє відмінну фунгіцидну дію стосовно стійких бактерій. Прикладами стійких бактерій є: бактеріальна сіра гниль (*Botrytis cinerea*), бактеріальна бура плямистість цукрового буряку (*Cercospora beticola*), бактеріальна парша яблук (*Venturia inaequalis*), бактеріальна парша груші (*Venturia nashicola*), стійкі до бензімідазольного фунгіциду, такого як тіофенат-метил, беноміл або карбендазим; Бактеріальна сіра гниль (*Botrytis cinerea*) стійка до дикарбоксамідного фунгіциду (такого як віנקлозолін, процимідон або іпродіон) і т.і.

40 Прикладами захворювань, при яких застосування фунгіциду згідно з представленим винаходом є більш переважним є парша яблук, сіра гниль огірків, справжня борошниста роса пшениці, фітофтороз томату, листова іржа пшениці, шийкова гниль рису, в'янення огірків і т.і.

Також, фунгіцид згідно з представленим винаходом є агентом з низькою фітотоксичністю, низькою токсичністю для риб або теплокровних тварин і високобезпечним.

45 Фунгіцид згідно з представленим винаходом може бути використаний в агрохімічно прийнятній формі, тобто, у формі агрохімічної рецептури, такої як порошок, що диспергується у воді, гранули, порошок, емульсія, водорозчинний порошок, суспензія або гранули, що диспергуються у воді.

50 Прикладами добавок і носіїв використовуваних в твердій рецептурі є: рослинний порошок, такий як соєве борошно або пшеничне борошно; мінеральний тонкоподрібнений порошок, такий як діатоміт, апатит, гіпс, тальк, бентоніт, пірофіліт або глина; органічна або неорганічна сполука, така як бензоат натрію, сечовина або сульфат натрію; і т.і.

55 Прикладами розчинника використовуваного в рідкій рецептурі є: ароматичний вуглеводень, такий як керосин, ксилен або нафтові ароматичні вуглеводні; циклогексан, циклогексанон, диметилформамід, диметилсульфоксид, спирт, ацетон, трихлоретилен, метилізобутилкетон, мінеральна олія, рослинна олія, вода і т.і.

Також, якщо необхідно, в рецептури для збереження однорідності і стабільності форми, може додаватись поверхнево-активна речовина.

60 Поверхнево-активна речовина, що додається, спеціально не обмежується. Прикладами поверхнево-активної речовини є: неіонна поверхнево-активна речовина, така як

поліоксиетилен-приєднаний алкілфенілетер, поліоксиетилен-приєднаний алкілетер, поліоксиетилен-приєднаний естер вищої жирної кислоти, поліоксиетилен-приєднаний естер сорбіту і вищої жирної кислоти, поліоксиетилен-приєднаний тристирилфенілетер; сіль естеру сірчаної кислоти і поліоксиетилен-приєданого алкілфенілетеру, алкілбензолсульфонат, сіль естеру сірчаної кислоти і вищого спирту, алкілнафталінсульфонат, полікарбоксилат, лігнінсульфонат, формаьдегідний конденсат алкілнафталінсульфонату, співполімер ізобутилен-безводна малеїнова кислота і т.і.

Одержаний таким чином порошок, що диспергується у воді, емульсію, текучий агент, водорозчинний порошок або гранули, що диспергуються у воді, розводять водою до визначеної концентрації і використовують як розчин, суспензію або емульсію для розпилення на рослини. Також, порошок і гранули використовують для розпилення на рослини як вони є.

Кількість фунгіциду згідно з представленим винаходом, нормально стосовно загальної кількості рецептури, становить переважно 0,01 - 90 мас.%, і більш переважно 0,05 - 85 мас.%.

Норма застосування фунгіциду згідно з представленим винаходом, хоча вона і змінюється в залежності від погодних умов, форми рецептури, часу застосування, способу застосування, оброблюваної площі, цільового захворювання або цільової культури, нормально як кількість активного інгредієнта сполуки на 1 гектар, становить 1 - 1000 г, і переважно 10 - 100 г.

Коли порошок, що диспергується у воді, емульсію, суспензію, водорозчинний порошок або гранули, що диспергуються у воді, розводять водою, застосовувана концентрація становить 1 - 1000 м.ч., і переважно 10 - 250 м.ч..

Фунгіцид згідно з представленим винаходом може бути змішаний з іншими фунгіцидами або інсектицидами/акарицидами, або синергічними агентами.

Характерні приклади інших фунгіцидів, інсектицидів, акарицидів і регуляторів росту рослин, що можуть бути змішані і використані з фунгіцидом згідно з представленим винаходом, показані нижче.

Фунгіцид:

бензоімідазоли, такі як бонеміл, карбендазим, фуберидазол, тріабендазол або тіофанат-метил;

дикарбоксаміди, такі як клозолінат, іпродіон, процимідон або вінклозолін;

DMI-фунгіцид, такий як імазаліл, окспоконазол, перфразоат, прохлораз, трифлумізол, трифорин, пірифенокс, фенаримол, нуарімол, азаконазол, бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флуквіконазол, фулсилазол, флутриафол, гексаконазол, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, протіоконазол, сімеконазол, тебуконазол, тетраконазол, тіриадимефон, триадименол, тритиконазол, етаконазол, фурконазол-цис, іпконазол або імібенконазол;

феніламіді, такі як беналаксил, фуралаксил, металаксил, металаксил-М, оксадиксил або офурас;

аміни, такі як алдіморф, додеморф, фенпропіморф, тридеморф, фенпропідин, піпералин або спіроксамін;

фосфоротіолати, такі як EDDP, іпробенфос, піразофос;

дітіолани, такі як ізопротіолан;

карбоксаміди, такі як беноданіл, боскалід, карбоксин, фенфуран, флутоланіл, фураметпір, мепроніл, оксикарбоксин, пентіопірад або тіфлузамід;

гідрокси-(2-аміно)піримідин, такий як бупурімат, диметірімол або етірімол;

AP фунгіцид (анілінопіримідин), такий як ципродиніл, мепаніпірим або піриметьаніл;

N-фенілкарбамат, такий як діетофенкарб;

QoI-фунгіцид (Qo інгібітор), такий як азоксистробін, піоксистробін, піраклостробін, крезоксим-метил, трифлуксистробін, димоксистробін, метоміностробін, орісастробін, фамоксадон, флуоксастробін, фенамідон, метомінофен, пірибенкарб;

PP фунгіцид (фенілпірол), такий як фенпіконіл, флудіоксоніл;

хіноліни, такі як хіноксифен;

АН фунгіцид (ароматичний вуглеводень), такий як біфеніл, хлоронеб, диклоран, хінтозен, текназен або толктфос-метил;

MBI-R, такий як фталід, пірохілон або триклазол;

MBI-D, такий як карпропамід, диклоцимет або феноксаніл;

SBI агент, такий як фенгексамід, пірибутикарб або тербінафін;

фенілсечовина, така як пенцикурон;

QiI-фунгіцид (Qi інгібітор), такий як циазафамід;

бензамід, такий як зоксамід;

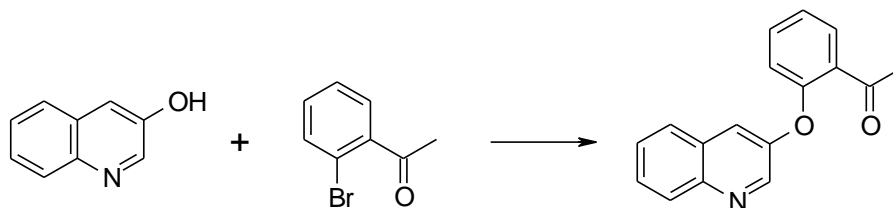
- енопіранурон, такий як бластицидин, мілдіоміцин;
гексопіранозил, такий як казугаміцин;
глюкопіраноцил, такий як стрептоміцин, валідаміцин;
ціаноацетамід, такий як цимоксаніл;
- 5 карбамат, такий як пропамокарб, протіокарб або полікарбамат;
незв'язуючий агент, такий як бінапакрил, динокап, ферімзон або флуазинам;
органолов'яна сполука, така як трифенілолова ацетат, трифенілолова хлорид або
трифенілолова гідроксид;
- 10 органофосфат, такий як фосфорна кислота, толклофос-метил або фозетил;
фталамова кислота, така як теклофталам;
бензотриазин, такий як триазоксид;
бензолсульфонамід, такий як флусулфамід;
піридазинон, такий як дикломезин;
САА фунгіцид (амід карбонової кислоти), такий як диметоморф, флуморф, бентіавалікарб,
- 15 іпровалікарб або мандіпропамід;
тетрациклін, такий як окситетрациклін;
тіокарбамат, такий як метасульфоккарб; або
інші сполуки, такі як етрідіазол, поліоксин, оксолінова кислота, гідроксиізоксазол, октинолін,
сілтіофам, дифлуметорим, ацибензолар-S-метил, пробеназол, тіадиніл, етабоксам,
- 20 цифлуфенамід, прохіназид, метрафенон, флуопіколід, гідроксид міді (II), органомідні сполуки,
сірка, фербам, манзеб, манеб, метірам, пропінеб, тіурам, зинеб, зирам, каптан, каптафол,
фолпет, хлороталоніл, дихлофлуанід, толілфлуанід, додин, гуазатин, іміноктадин, анілазин,
дитіанон, хлоропикрин, дазомет, метам-натрій, чінометіонат, ципрофурам, сілтіофам, агро-
бактерія або фторімід.
- 25 Інсектициди · акарициди:
Органофосфорні і карбаматні інсектициди:
фентіон, фенітротіон, діазінон, хлорпірифос, ESP, вамідотіон, фентоат, диметоат,
формотіон, малатон, трихлорхон, тіометон, фосмет, дихлорвос, ацефат, EPBP, метилпаратіон,
оксидеметон-метил, етіон, салітіон, ціанофос, ізоксатіон, піридафентіон, фосалон, метідатіон,
- 30 сульпрофос, хлорфенвінфос, тетрахлорвінфос, диметилвінхос, пропафос, ізофенфос,
етилтіометон, профенофос, піраклофос, монокротофос, азинфос-метил, алдікарб, метоміл,
тіодікарб, карбофуран, карбосульфам, бенфуракарб, фураціокарб, пропоксур, BPMC, MTMC,
MIPC, карбарил, піримікарб, етіофенкарб, феноксикарб, EDDP або т.і.
піретроїдні інсектициди:
- 35 перметрин, циперметрин, дельтаметрин, фенвалерат, фенпропатрин, піретрин, аллетрин,
тетраметрин, ресметрин, диметрин, пропатрин, фенотрин, протирін, флувалінат, цифлутрин,
цигалотрин, флуцитрінат, етофенпрокс, циклопроптрин, тралометрин, сілафлуофен,
брофенпрокс, акринатрин або т.і.
Інші інсектициди бензоїлсечовинного ряду:
- 40 мікробні агрохімікати, такі як дифлубензурон, хлорфдуазурон, гексафлумурон,
трифлумурон, тетрабензурон, флуфеноксурон, флуциклоксурон, бупрофезин, пірипроксифен,
метопрен, бензоєпін, діалфентіурон, ацетаміприд, імідаклоприд, нітенпірам, фіпроніл, картап,
тіоциклам, бенсултап, нікотинсульфат, ротенон, метальдегід, машинна олія, ВТ,
комахоматогенні віруси або т.і.
- 45 Нематоциди:
Фенаміфос, фостіазат або т.і.
Акарициди:
хлорбензилат, фенізобромолат, дикофол, амітраз, BPPS, бензозат, гекситіазокс,
фенбутатин оксид, полінактини, чінометіонат, CPCBS, тетрадіфон, авермектин, мілбемектин,
- 50 клофентезин, цигексатин, піридабен, фенпіроксимат, тебуфенпірад, піримідифен, фенотіокарб,
діенохлор або т.і.
Регулятор росту рослин:
абсцизова кислота, індолмасляна кислота, уніконазол, етилклозат, етефон, клоксифонак,
хлормекват, екстракт хлорелли, пероксид кальцію, ціанамід, дихлорпроп, гіббереллін,
- 55 дамінозид, дециловий спирт, тринексапак-етил, мепікват хлорид, паклобутразол, парафін, віск,
піперонілу бутоксид, пірафлуфен-етил, флурпримідол, прогідроясмон, прогексадіон-кальцій,
бензиламінопурин, пендіметалін, форхлорфенурон, малеїнгідрозид калію, 1-нафтилацетамід, 4-
CRA, MCPB, коррін, оксихінолін сульфат, етиклозат, бутралін, 1-метилциклопропен, авігліцину
гідрохлорид.
- 60 [Приклади]

Тут далі, представлений винахід описується більш детально з посиланням на приклади, однак, представлений винахід не обмежується в найменшому ступені наступними прикладами.

Приклад 1

Синтез 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону

5



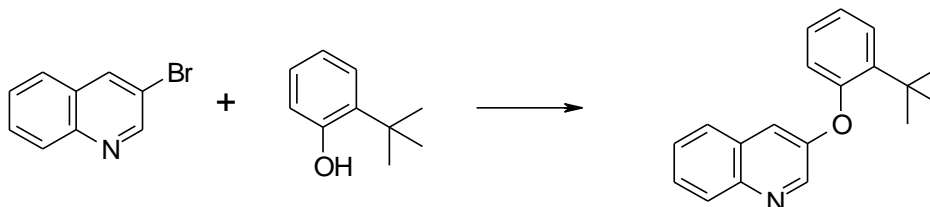
10 0,73 г 3-хінолінолу, 1,8 г карбонату цезію, 0,18 г дипівалоїлметану, 2,0 г 2-бромацетофенону і 0,50 г хлориду міді (I) розчиняли в 10 мл N-метилпіролідону і суміш перемішували протягом 3 годин при 130°C. Одержаний продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі і одержували 0,82 г 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону (Сполука номер 1).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 2 - 13 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 1.

Приклад 2

15

Синтез 3-(2-т-бутил-фенокси)-хіноліну



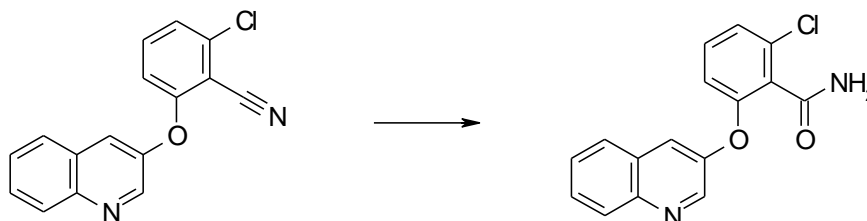
20 0,60 г 2-т-бутилфенолу, 1,3 г карбонату цезію, 0,07 г дипівалоїлметану, 0,42 г 3-бромхіноліну і 0,20 г хлориду міді (I) розчиняли в 4 мл N-метилпіролідону і суміш перемішували один день при 130°C. Одержаний продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі і одержували 0,04 г 3-(2-т-бутил-фенокси)-хіноліну (Сполука номер 14).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 15 - 19 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 2.

25

Приклад 3

Синтез 2-хлор-6-(хінолін-3-ілокси)-бензаміду

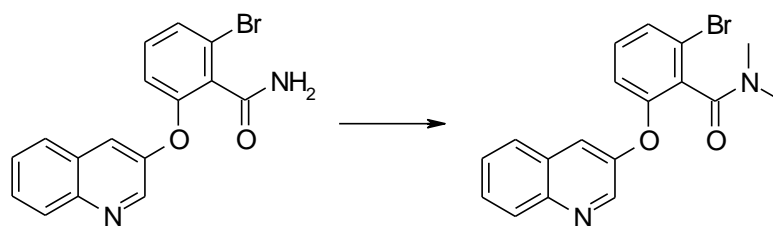


30 1,18 г 2-хлор-6-(хінолін-3-ілокси)-бензонітрилу розчиняли в 5 мл 80% сірчаної кислоти і суміш перемішували протягом 3 годин при 100°C. Після нейтралізації водним розчином гідроксиду натрію, рідину розділяли етилацетатом, органічний шар концентрували і одержували 1,03 г 2-хлор-6-(хінолін-3-ілокси)-бензаміду (Сполука номер 20).

35 Сполуку представлену Сполукою номер 21 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 3.

Приклад 4

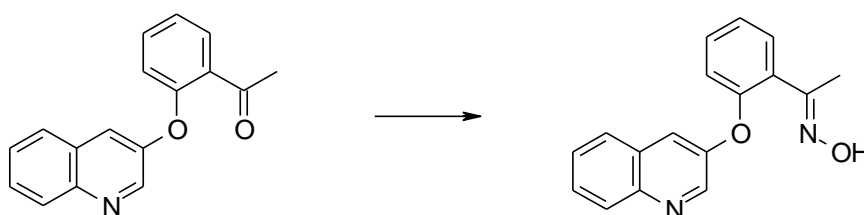
Синтез 2-бром-N,N-диметил-6-(хінолін-3-ілокси)-бензаміду



Після розчинення 0,34 г 2-бром-6-(хінолін-3-ілокси)-бензаміду в 2 мл N-метилпіролідону, до нього при кімнатній температурі додавали 47 мг гідриду натрію. Після додавання до реакційної суміші 0,21 г метилйодиду, суміш нагрівали при 100°C і перемішували протягом 4 годин. Рідину розділяли етилацетатом, розчинник упарювали і одержаний продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,11 г 2-бром-N,N-диметил-6-(хінолін-3-ілокси)-бензаміду (Сполука номер 22).

Приклад 5

Синтез 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етаноноксиму

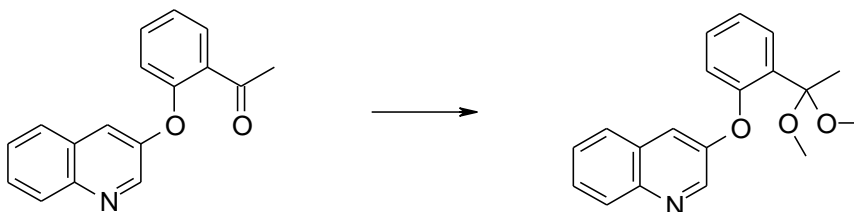


0,46 г 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону і 0,15 г гідрохлориду гідроксиламіну розчиняли в 3 мл піридину і потім суміш перемішували протягом 24 годин при кімнатній температурі. Після оброблення реакційної суміші розведеною хлорводневою кислотою і розділення етилацетатом, органічний шар концентрували одержуючи 0,54 г 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етаноноксиму (Сполука номер 23).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 24 - 26 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 5.

Приклад 6

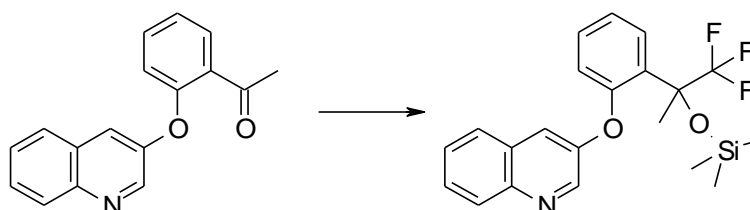
Синтез 3-[2-(1,1-диметокси-етил)-фенокси]-хіноліну



Після розчинення 0,13 г 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону і 0,06 г триметилорфтоформіату в 1,5 мл метанолу, додавали 0,02 г триброміду тетрабутиламонію і суміш перемішували протягом 4 днів при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували і потім очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,08 г 3-[2-(1,1-диметокси-етил)-фенокси]-хіноліну (Сполука номер 27).

Приклад 7

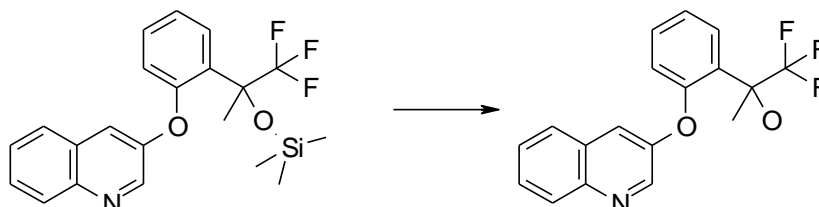
Синтез 3-[2-(2,2,2-трифтор-1-метил-1-триметилсиланілокси-етил)-фенокси]-хіноліну



Після розчинення 0,26 г 1-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону і 0,16 г (трифторметил)триметилсилану в 3 мл тетрагідрофурану, при охолодженні льодом додавали 2 краплі фториду тетрабутиламонію (1,0 М тетрагідрофурановий розчин) і потім перемішували протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,34 г 3-[2-(2,2,2-трифтор-1-метил-1-триметилсиланілокси-етил)-фенокси]-хіноліну (Сполука номер 28).

Приклад 8

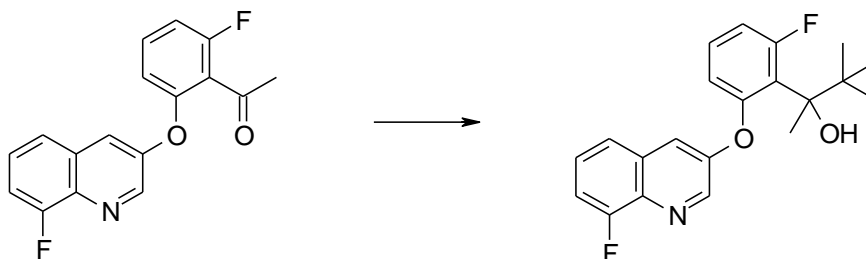
Синтез 1,1,1-трифтор-2-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-пропан-2-олу



0,17 г 3-[2-(2,2,2-трифтор-1-метил-1-триметилсиланілоксиетил)-фенокси]-хіноліну розчиняли в 1,5 мл тетрагідрофурану, додавали 1 мл фториду тетрабутиламонію (1,0 М тетрагідрофурановий розчин) і суміш перемішували протягом 16 годин. Реакційну суміш концентрували і потім очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,11 г 1,1,1-трифтор-2-[2-(хінолін-3-ілокси)-феніл]-пропан-2-олу (Сполука номер 29).

Приклад 9

Синтез 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-3,3-диметил-бутан-2-олу

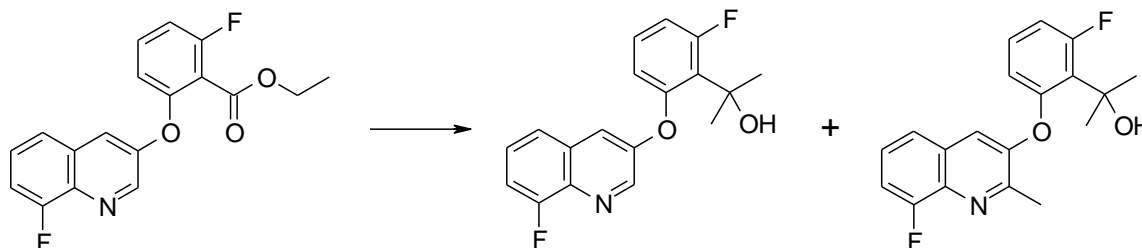


0,15 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону розчиняли в 1,5 мл тетрагідрофурану і потім розчин охолоджували до -78°C і краплями додавали 0,3 мл т-бутилмагнійхлорид (2,0 М розчин в діетиловому етері). Після підвищення температури реакційної суміші до кімнатної, реакційний розчин обробляли розведеною хлорводневою кислотою і потім рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і потім очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,04 г 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-3,3-диметилбутан-2-олу (Сполука номер 30).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 31 - 35 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 9.

Приклад 10

Синтез 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу і 2-[2-фтор-6-(8-фтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу

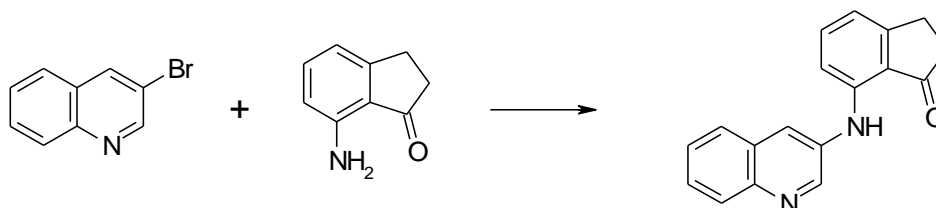


0,3 г 2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-бензойної кислоти етилового естеру розчиняли в 4,5 мл тетрагідрофурану, розчин охолоджували до -78°C і краплями додавали 0,77 мл метилмагнійхлориду (3,0 М розчин в діетиловому етері). Після підвищення реакційної температури до кімнатної температури, реакційний розчин обробляли розведеною хлорводневою кислотою і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і потім очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,12 г 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу (Сполука номер 36) і 0,05 г 2-[2-фтор-6-(8-фтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу (Сполука номер 37).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 38 - 49 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 10.

Приклад 11

Синтез 7-(хінолін-3-іламіно)-індан-1-ону

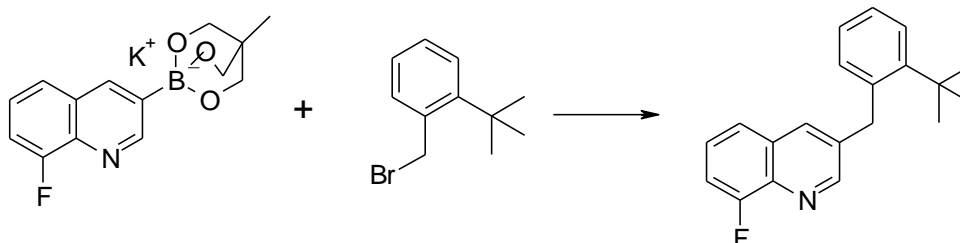


Змішували 0,43 г 3-бромхіноліну, 0,29 г 7-аміноіндан-1-ону, 0,08 г йодиду міді (I), 0,41 г карбонату калію і 4 мл N-метилпіролідону і потім суміш перемішували протягом 2 годин при 200°C . Одержаний суміш очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,15 г 7-(хінолін-3-іламіно)-індан-1-ону (Сполука номер 50).

Сполуку представлену Сполукою з номером 51 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 11.

Приклад 12

Синтез 3-(т-бутил-бензил)-8-фторхіноліну

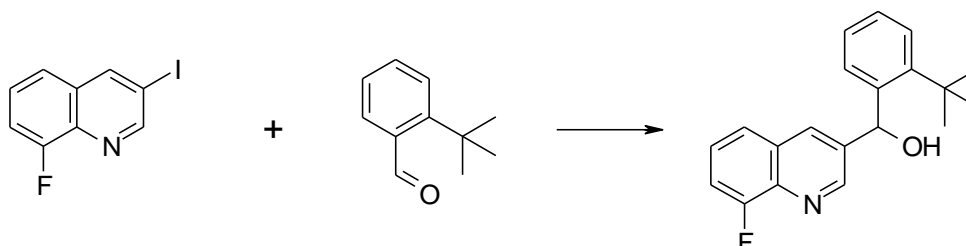


0,69 г тріольної солі, одержаної з 8-фторхінолін-3-борної кислоти і 1,1,1-трис(гідроксиметил)етану за способом описаним в літературі (Angew. Chem. Int. Ed., 2008, 47, 928-931) і 0,45 г 1-бромметил-2-т-бутилбензолу розчиняли в 10 мл толуолу, додавали 0,46 г тетаркістрифенілфосфінпаладію і суміш перемішували протягом 3 годин. Розчинник реакційної суміші упарювали, одержаний продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,14 г 3-(т-бутил-бензил)-8-фторхіноліну (Сполука номер 52).

Сполуку представлену Сполукою з номером 53 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 12.

Приклад 13

Синтез (2-т-бутил-феніл)-(8-фтор-хінолін-3-іл)-метанолу

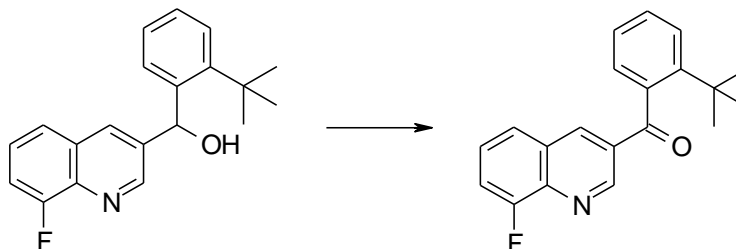


3 мл тетрагідрофурану охолоджували до -10°C , додавали 0,91 мл н-бутиллітії (2,6 М гексановий розчин) і 1,35 мл н-бутилмагнійхлорид (0,91 М тетрагідрофурановий розчин). Після 30 хвилин перемішування, додавали 0,98 г 8-фтор-3-йодхіноліну і суміш перемішували протягом 15 хвилин. До реакційного розчину додавали 0,49 г 2-т-бутилбензальдегіду і суміш перемішували протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали розведену хлорводневу кислоту, рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі, одержували 0,55 г (2-т-бутил-феніл)-(8-фтор-хінолін-3-іл)-метанолу (Сполука номер 54).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 55 - 56 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 13.

Приклад 14

Синтез (2-т-бутил-феніл)-(8-фтор-хінолін-3-іл)-метанолу



0,32 г (2-т-бутил-феніл)-(8-фтор-хінолін-3-іл)-метанолу розчиняли в 3 мл дихлорметану, додавали 0,51 г реагенту Деса-Мартіна і суміш перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі. Додавали воду і потім рідину розділяли етилацетатом, органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,21 г (2-т-бутил-феніл)-(8-фтор-хінолін-3-іл)-метанолу (Сполука номер 57).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 58 - 59 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 14.

Приклад 15

Синтез 2-хлор-3-(1,1-диметиліндан-7-ілокси)хіноліну

0,2 г 3-(1,1-диметиліндан-7-ілокси)хінолону розчиняли в 5 мл хлороформу і додавали 0,2 г m-CPBA (70%) і перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після розведення реакційної суміші хлороформом і промивання насиченим водним бікарбонатом натрію, додавали сульфат магнію для висушування одержаного продукту. Розчинник упарювали при пониженому тиску одержуючи 0,2 г 3-(1,1-диметиліндан-7-ілокси)хінолін-N-оксиду.

Одержаний продукт розчиняли в оксихлориді фосфору і нагрівали із зворотнім холодильником протягом 4 годин. Оксихлорид фосфору упарювали при пониженому тиску і залишок розчиняли в етилацетаті і промивали насиченим водним бікарбонатом натрію. Органічний шар сушили сульфатом магнію і упарювали при пониженому тиску. Неочищений продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі і одержували 0,13 г 2-хлор-3-(1,1-диметиліндан-7-ілокси)хіноліну (Сполука номер 60).

Сполуку представлену Сполукою номером 61 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 15.

Приклад 16

Синтез 3-(2-ціанофенокси)хіноліну

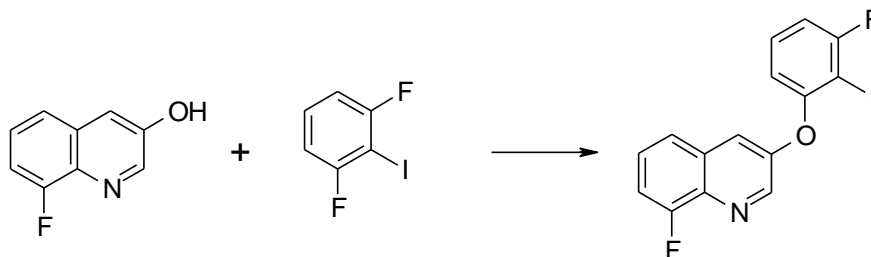
0,27 г 3-гідроксихіноліну розчиняли в N-метил-2-піролідоні, при охолодженні льодом додавали 0,087 г гідриду натрію (60% масляна дисперсія) і суміш перемішували протягом 30 хвилин. При тій же самій температурі, додавали 0,27 г 2-фторбензонітрилу і потім суміш перемішували протягом 6 годин при кімнатній температурі. Реакційну суміш виливали в льодяну воду, екстрагували етилацетатом і промивали насиченим розчином саліну, одержаний продукт сушили сульфатом магнію. Розчинник упарювали при пониженому тиску, неочищений продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,37 г 3-(2-ціанофенокси)хіноліну (Сполука номер 62).

Сполуки представлені Сполуками з номерами 63 - 66 синтезували таким же самим чином як і сполуку Прикладу 16.

Приклад 17

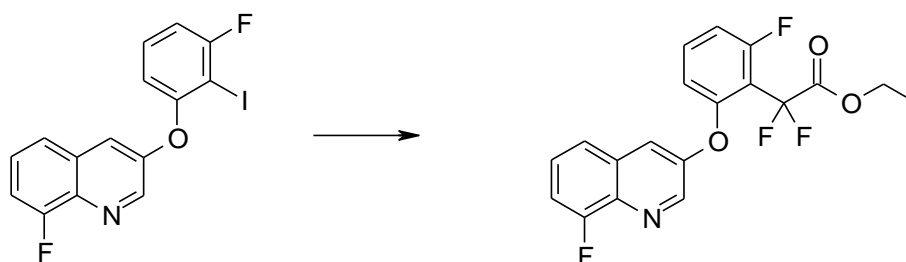
Синтез дифтор-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-етилацетату]

Стадія 1) Синтез 8-фтор-3-(3-фтор-2-йодфенокси)-хіноліну



5 16 мл N-метилпіролідону додавали до 1,06 г 8-фтор-3-гідроксихіноліну, 1,94 г 2,6-дифторйодбензолу і 1,7 г карбонату калію і суміш перемішували протягом 24 годин при 130°C. Реакційний розчин очищали колонковою хроматографією на силікагелі і одержували 0,55 г 8-фтор-3-(3-фтор-2-йодфенокси)-хіноліну.

Стадія 2) Синтез дифтор-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-етилацетату

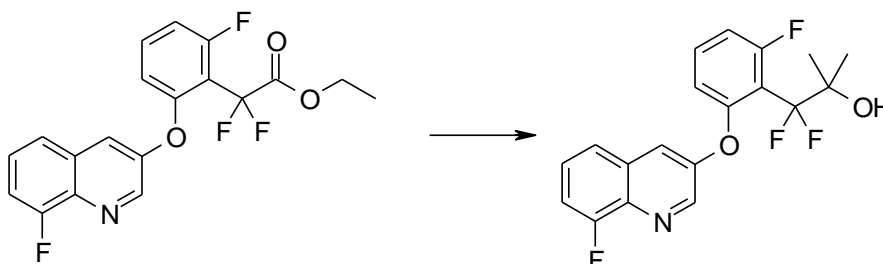


10

15 0,4 г 8-фтор-3-(3-фтор-2-йодфенокси)-хіноліну розчиняли в 4 мл диметилсульфоксиду, додавали 0,25 г міді (порошок) і 0,41 г бромдифторетилацетату і потім суміш перемішували протягом 24 годин при 40°C. Реакційний розчин очищали колонковою хроматографією на силікагелі, і одержували 0,27 г дифтор-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-етилацетату (Сполука номер 292).

Приклад 18

Синтез 1,1-дифтор-1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-метил-пропан-2-олу



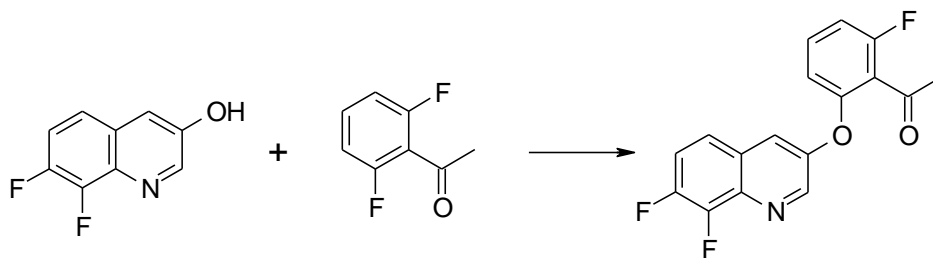
20

25 0,18 г дифтор-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-етилацетату розчиняли в 3 мл тетрагідрофурану і краплями при 0°C додавали 0,4 мл метилмагнійхлориду (3,0 М тетрагідрофурановий розчин). Суміш перемішували протягом 2 годин при 0°C, додавали розведену хлорводневу кислоту і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,10 г 1,1-дифтор-1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-метил-пропан-2-олу (Сполука номер 293).

Приклад 19

Синтез 1-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]етанону

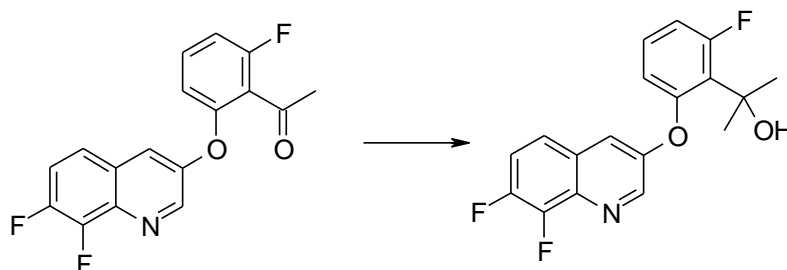
30



0,91 г 7,8-дифтор-3-гідроксикіноліну і 0,94 г 2,6-дифторацетофенону розчиняли в 10 мл диметилформаміду, додавали 0,9 г карбонату калію. Реакційний розчин нагрівали при 100°C і суміш перемішували протягом 4,5 годин. До реакційного розчину додавали розведену хлорводневу кислоту і розчин розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,64 г 1-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-етанону (Сполука номер 391).

Приклад 20

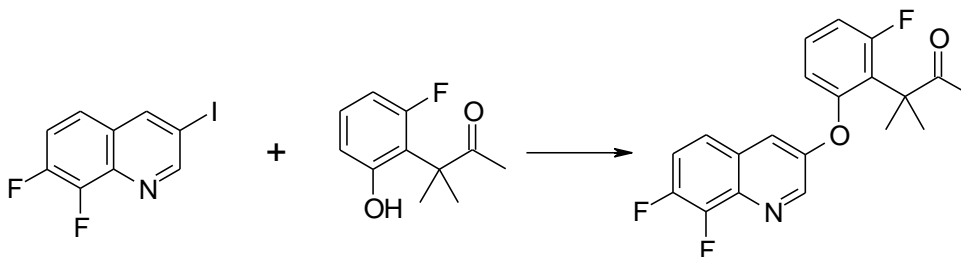
Синтез 2-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-пропан-2-олу



0,64 г 1-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-етанону розчиняли в 10 мл тетрагідрофурану, одержаний продукт охолоджували до 0°C і краплями додавали 1,5 мл метилмагнійхлориду (3,0 М тетрагідрофурановий розчин). До реакційного розчину додавали розведену хлорводневу кислоту і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,49 г 2-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-пропан-2-олу (Сполука номер 124).

Приклад 21

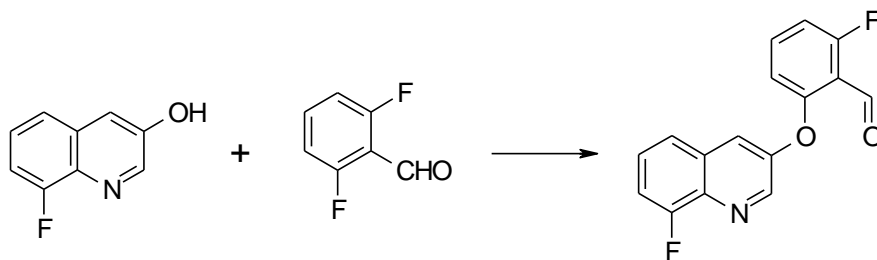
Синтез 3-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-3-метил-бутан-2-ону



3 мл N-метилпіролідону додавали до 0,78 г 7,8-дифтор-3-йодхіноліну, 0,26 г 3-(2-фтор-6-гідроксифеніл)-3-метил-бутан-2-ону, 1,05 г карбонату цезію, 53 мг дипівалоїлметану і 0,27 г хлориду міді (I). Після 48 годин перемішуванні при 130°C, реакційний розчин фільтрували через CELITE і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,05 г 3-[2-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-6-фтор-феніл]-3-метил-бутан-2-ону (Сполука номер 267).

Приклад 22

Синтез 2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-бензальдегіду

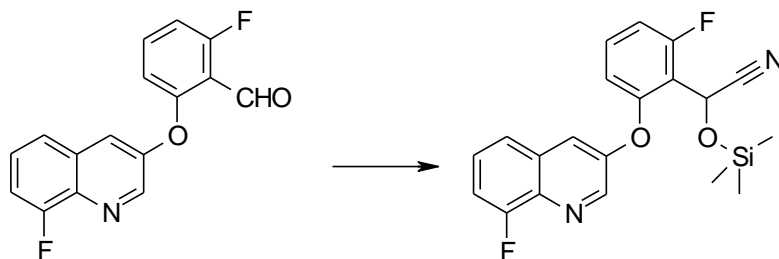


30 мл ацетонітрилу додавали до 3,0 г 8-фтор-3-гідроксикіноліну, і потім додавали 3,1 г карбонату калію і 3,5 г 2,6-дифторацетофенону. Реакційний розчин нагрівали із зворотнім холодильником протягом 3 годин, реакційний розчин фільтрували через CELITE. Фільтрат екстрагували етилацетатом, органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 3,0 г 2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-бензальдегіду (Сполука номер 341).

Приклад 23

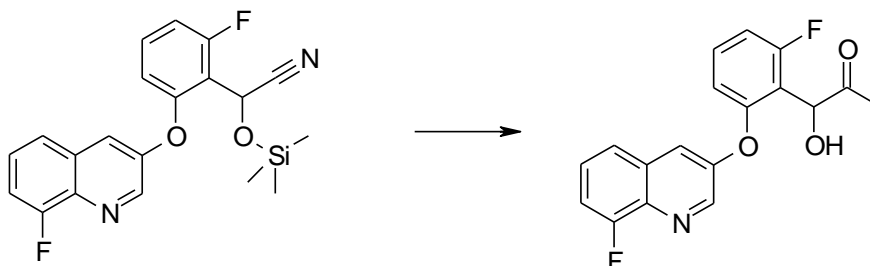
Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-пропан-1,2-діону

Стадія 1) Синтез [2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-триметилсилілокси-ацетонітрилу



3,2 г 2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-бензальдегіду розчиняли в 70 мл дихлорметану і одержаний продукт охолоджували до 0°C, додавали 1,3 г тетраізопропоксиду титану. Реакційний розчин нагрівали до кімнатної температури, додавали 4,5 г триметилсиліліціаніду і суміш перемішували протягом 2 годин. До реакційного розчину додавали розведену хлорводневу кислоту і розчин екстрагували дихлорметаном. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 3,1 г [2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-триметилсилілокси-ацетонітрилу (приблизно 90% чистота).

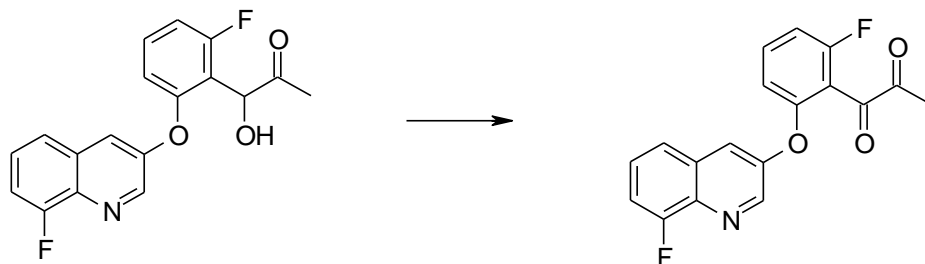
Стадія 2) Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]-1-гідрокси-пропан-2-ону



3,3 г [2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-триметилсилілокси-ацетонітрилу (приблизно 90% чистота) розчиняли в 50 мл діетилового етеру і краплями при кімнатній температурі додавали 5,7 мл метилмагнійброміду (3,0 М розчин в діетиловому етері). Суміш перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі, одержаний продукт нагрівали із зворотнім холодильником протягом 3 годин і потім обробляли розведеною хлорводневою кислотою. Одержаний продукт піддавали екстракції етилацетатом і потім органічний шар концентрували одержуючи 3,9 г неочищеного продукту. 20 мл 2N хлорводневої кислоти і 10 мл тетрагідрофурану додавали до 1,9 г неочищеного продукту і суміш перемішували протягом 4 годин при кімнатній температурі. Реакційний розчин екстрагували етилацетатом і потім

очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,4 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-1-гідрокси-пропан-2-ону.

Стадія 3) Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-пропан-1,2-діону



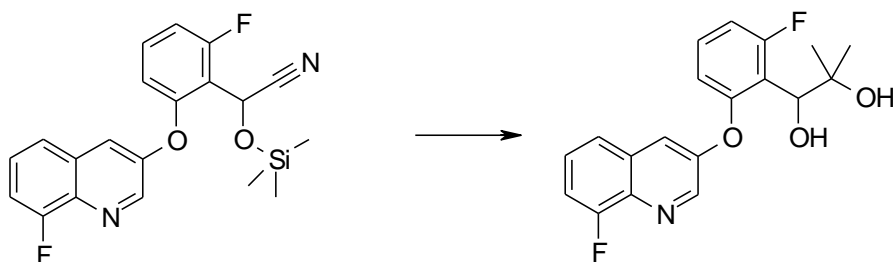
5

0,14 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-1-гідрокси-пропан-2-ону розчиняли в 10 мл дихлорметану, при 0°C додавали 0,91 г реагенту Деса-Мартіна. Після 3 годин перемішування, реакційний розчин концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,08 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-пропан-1,2-діону (Сполука номер 396).

Приклад 24

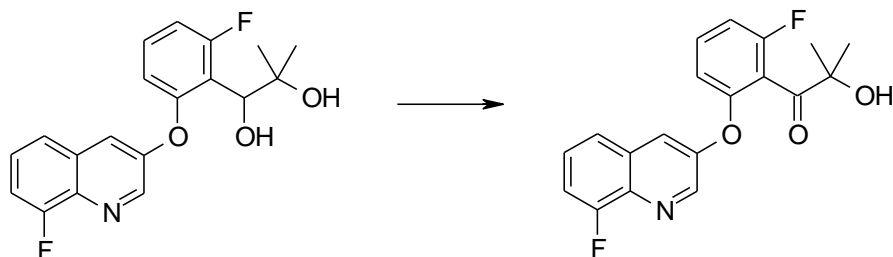
Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]-2-гідрокси-2-метил-пропан-1-ону

Стадія 1) Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-гідрокси-2-метил-пропан-1,2-діолу



3,3 г [2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-триметилсилілокси-ацетонітрилу розчиняли в 50 мл діетилового етеру і краплями при кімнатній температурі додавали 5,7 мл метилмагнійброміду (3,0 М розчин в діетиловому етері). Суміш перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі, одержаний продукт нагрівали із зворотнім холодильником протягом 3 годин і потім обробляли розведеною хлорводневою кислотою. Одержаний продукт піддавали екстракції етилацетатом і потім органічний шар концентрували одержуючи 3,9 г неочищеного продукту. 1,9 г неочищеного продукту розчиняли в 20 мл тетрагідрофурану і краплями при 0°C додавали 3,2 мл метилмагнійброміду (3,0 М розчин в діетиловому етері). Після 3 годин перемішування при 0°C, додавали 20 мл 2N хлорводневої кислоти і суміш перемішували один день при кімнатній температурі. Реакційний розчин екстрагували етилацетатом і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,25 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-метил-пропан-1,2-діолу як неочищений продукт.

Стадія 2) Синтез 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-гідрокси-2-метил-пропан-1-ону



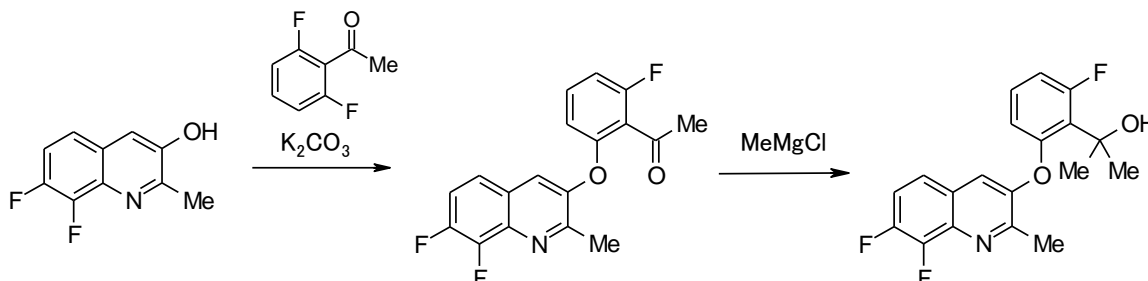
35

0,15 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-метил-пропан-1,2-діолу розчиняли в 10 мл дихлорметану і при 0°C додавали 0,20 г реагенту Деса-Мартіна. Після 2 годин перемішування, реакційний розчин концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,03 г 1-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)-феніл]-2-гідрокси-2-метил-пропан-1-ону (Сполука номер 398).

5

Приклад 25

Синтез 2-[2-фтор-6-(7,8-дифтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу



10

26,3 г 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхіноліну розчиняли в 200 мл диметилформаміду. До розчину додавали 27,2 г 2,6-дифторацетофенону і 24,0 г карбонату калію і суміш перемішували протягом 4 годин при 100°C. Потім одержаний таким чином реакційний розчин виливали в льодяну воду і нейтралізували розведеною хлорводневою кислотою, рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 17,0 г 1-[2-фтор-6-(7,8-дифтор-2-метилхінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону.

15

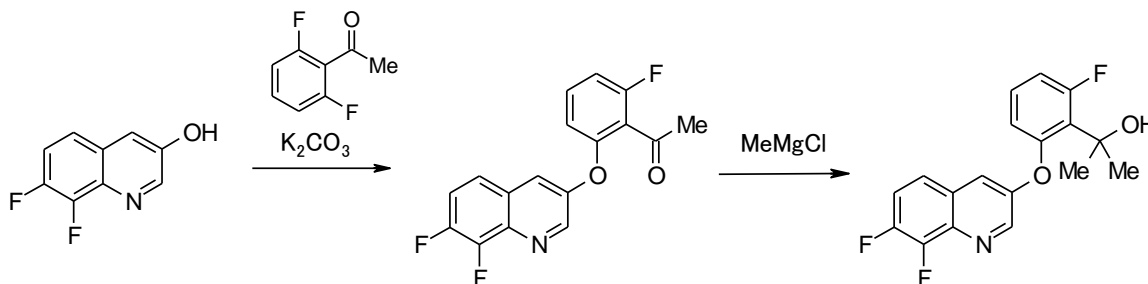
11,0 г одержаного 1-[2-фтор-6-(7,8-дифтор-2-метилхінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону розчиняли в 80 мл тетрагідрофурану і охолоджували до 0°C, краплями додавали 16,6 мл метилмагнійхлориду (3,0 М тетрагідрофурановий розчин). Одержаний продукт нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом 2 годин, реакційний розчин обробляли розведеною хлорводневою кислотою і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 10,0 г 2-[2-фтор-6-(7,8-дифтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу (Сполука номер 125).

20

Приклад 26

25

Синтез 2-[2-фтор-6-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу



30

0,5 г 7,8-дифтор-3-гідроксихіноліну розчиняли в 10 мл диметилформаміду. До розчину додавали 0,52 г 2,6-дифторацетофенону і 0,46 г карбонату калію і суміш перемішували протягом 2,5 годин при 100°C. Одержаний таким чином реакційний розчин виливали в льодяну воду і потім нейтралізували розведеною хлорводневою кислотою, рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,38 г 1-[2-фтор-6-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону (Сполука номер 391).

35

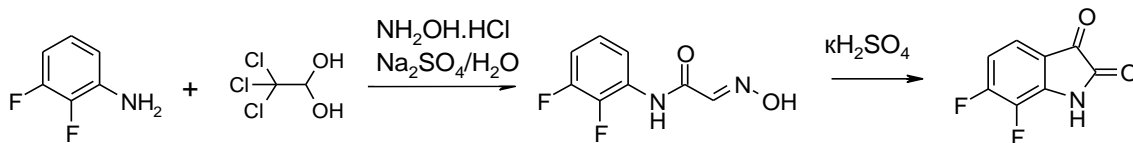
0,38 г одержаного 1-[2-фтор-6-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)-феніл]-етанону розчиняли в 5 мл тетрагідрофурану і охолоджували до 0°C, краплями додавали 1,4 мл метилмагнійброміду (3,0 М розчин в діетиловому етері). Одержаний продукт нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом 2 годин, реакційний розчин обробляли розведеною хлорводневою кислотою і рідину розділяли етилацетатом. Органічний шар концентрували і очищали колонковою хроматографією на силікагелі одержуючи 0,33 г 2-[2-фтор-6-(7,8-дифторхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олу (Сполука номер 124).

40

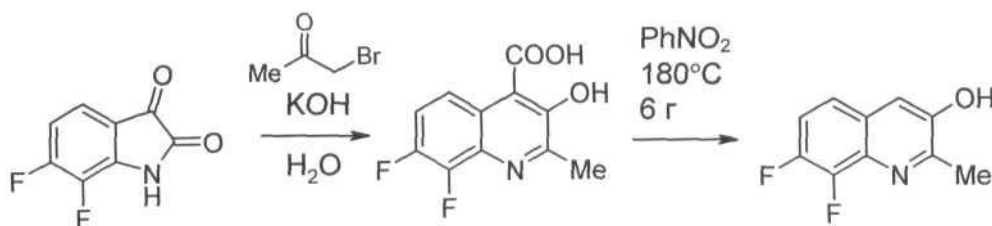
Тут далі, проміжна сполука згідно з представленим винаходом описується більш детально з посиланням на приклади, однак, проміжна сполука згідно з представленим винаходом не повинна в будь-якому ступені обмежуватись наступними прикладами.

Приклад 27

- 5 Синтез 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхіноліну
Стадія 1) Синтез 6,7-дифторізатину



- 10 15,7 г 2,3-дифтораніліну додавали до 825 мл води і потім додавали 24,2 г трихлорацетальдегід 1-гідрату, 30,8 г гідрохлориду гідроксиламіну, 138,6 г безводного сульфату натрію, суміш перемішували протягом 10 годин при 50°C. Одержаний продукт охолоджували до кімнатної температури, додавали 44 мл 2N хлорводневої кислоти і потім перемішували протягом 30 хвилин, після чого збирали кристали фільтруванням. Одержані таким чином
- 15 кристали сушили і потім додавали до концентрованої сірчаної кислоти нагрітої до 70°C, суміш перемішували протягом 1 години при 80 - 90°C. Реакційний розчин виливали на лід, після чого екстрагували етилацетатом і потім промивали насиченим розчином саліну. Органічний шар сушили сульфатом магнію, розчинник упарювали при пониженому тиску одержуючи 26 г неочищеного 6,7-дифторізатину.
- 20 Стадія 2) Синтез 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхіноліну



- 25 41 г неочищеного 6,7-дифторізатину додавали до 200 мл води, при охолодженні льодом додавали 75,3 г гідроксиду калію (6 еквівалентів) і суміш перемішували протягом 30 хвилин. До суспензії краплями додавали 42 г бромацетофенону (1,4 еквіваленти) підтримуючи внутрішню температуру реакційного розчину на рівні 20 - 25°C і суміш ще перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Одержаний продукт нейтралізували концентрованою хлорводневою кислотою, одержані кристали збирали фільтруванням і промивали малою кількістю води.
- 30 Одержані таким чином кристали були достатньо сухими і потім поступово додавали до 100 мл нітробензолу нагрітого до 130 - 140°C і суміш перемішували ще 1 годину при 150°C. Реакційний розчин охолоджували до кімнатної температури, одержані кристали промивали хлороформом одержуючи 26,3 г 7,8-дифтор-3-гідрокси-2-метилхіноліну.

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d6) δ 2,57 (с, 3H), 7,4 - 7,7 (м, 3H), 10,60 (шс, 1H).

- 35 Наступну сполуку одержували за такою ж самою методикою.

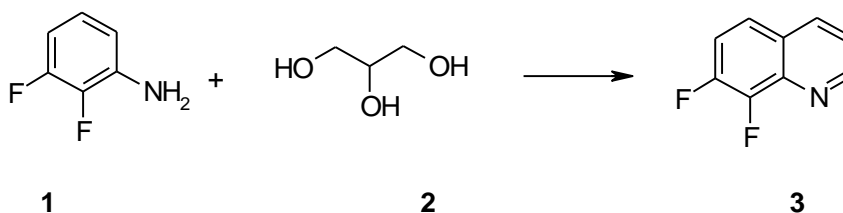
8-фтор-3-гідрокси-2-метилхінолін

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d6) δ 2,56 (с, 3H), 7,2 - 7,6 (м, 4H), 10,53 (шс, 1H).

Приклад 28

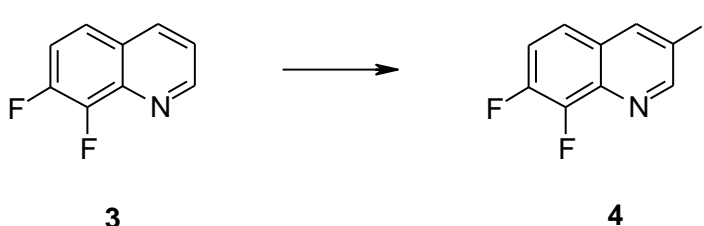
Синтез 7,8-дифтор-3-гідроксихіноліну

- 40 Стадія 1) Синтез 7,8-дифторхіноліну



3 л круглодонну колбу, що містить магнітну мішалку, вводили 80% сірчаної кислоти (607,7 г, 49,57 моль) і охолоджували до 0°C і потім повільно додавали 2,3-дифторанілін (160,0 г, 1,24 моль). Після додавання, суміш перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі, потім додавали йодид натрію (1,85 г, 12,3 ммоль) і потім суміш нагрівали на масляній бані до підвищення температури до 150°C (температура бані). Коли вона нагрівалась до такої температури, протягом години краплями додавали гліцерин (125,5 г, 1,36 моль) і суміш перемішували протягом 1 години при 150°C. Температуру бані підвищували до 180°C і воду упарювали протягом 2 годин використовуючи дистиляційний пристрій. Після підтвердження використання вихідного матеріалу, суміш нейтралізували використовуючи 10N водний гідроксид натрію з одночасним охолодженням на бані лід-вода (внутрішня температура - 60-70°C). Після нейтралізації і повернення внутрішньої температури до кімнатної температури, одержаний продукт піддавали екстракції етилацетатом і екстракт сушили сульфатом магнію, фільтрували і концентрували. Одержаний таким чином неочищений продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі (нормальний гексан: етилацетат) одержуючи 185,5 г 7,8-дифторхіноліну (91%) як світло-коричневу тверду речовину.

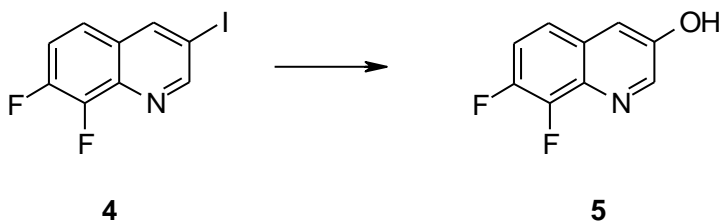
Стадія 2) Синтез 7,8-дифтор-3-йодхіноліну



У 3 л круглодонну колбу, що містить магнітну мішалку, вводили 7,8-дифторхінолін (185,5 г, 1,12 моль), N-йодсукцинімід (505,4 г, 2,25 моль) і оцтову кислоту (927 мл) і суміш перемішували протягом 30 годин при 90°C. Після охолодження, одержані кристали фільтрували і сушили. З іншого боку, фільтрат концентрували при пониженому тиску, оцтову кислоту, що залишилась, нейтралізували гідрокарбонатом натрію і одержаний продукт піддавали екстракції етилацетатом. Потім, фільтрат сушили сульфатом магнію, фільтрували і концентрували, одержаний таким чином неочищений продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі (нормальний гексан: етилацетат) одержуючи 227,2 г (70%) 7,8-дифтор-3-йодхіноліну як світло-коричневу тверду речовину, що об'єднували з попередньо одержаними кристалами.

¹H-ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,39 - 7,51 (м, 2H), 8,55 (м, 1H), 9,08 (д, 1H, J = 2,1 Гц).

Стадія 3) Синтез 7,8-дифтор-3-гідроксихіноліну



У 3 л круглодонну колбу, що містить магнітну мішалку, вводили 7,8-дифтор-3-йодхінолін (227,2 г, 0,78 моль), диметилсульфоксид (600 мл) і воду (600 мл) і додавали гідроксид натрію (131,5 г, 2,34 моль), CuI (14,8 г, 0,078 моль) і 1,10-фенантролін (28,1 г, 0,156 моль). Суміш нагрівали до 100°C на масляній бані і перемішували протягом 24 годин. Після охолодження, органічний шар видаляли додаючи етилацетат і воду. Одержаний таким чином водний шар нейтралізували концентрованою хлорводневою кислотою і потім одержані кристали фільтрували і сушили. Потім, фільтрат екстрагували етилацетатом, сушили сульфатом магнію, фільтрували і концентрували, неочищений продукт очищали колонковою хроматографією на силікагелі (нормальний гексан: етилацетат) одержуючи 133,7 г (95%) 7,8-дифтор-3-гідроксихіноліну як світло-коричневу тверду речовину, що об'єднували з попередньо одержаними кристалами.

¹H-ЯМР (300 МГц, CD₃OD) δ 7,39 - 7,60 (м, 3H), 8,59 (д, 1H, J = 2,4 Гц).

Наступну сполуку одержували за такою ж самою методикою.

8-фтор-3-гідроксихінолін

¹H-ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,16 (м, 1H) δ 7,34 - 7,49 (м, 3H), 8,71 (д, 1H, J = 2,7 Гц), 9,90 (шс, 1H).

Азотвмісні гетероциклічні сполуки одержані в приведених вище прикладах показані в Таблицях 1 - 19. Крім того, сполуки синтезовані таким же самим чином як і будь-які показані в приведених вище прикладах також показані в Таблиці 20 - Таблиці 28. Також, Et представляє етильну групу, ⁿPr представляє н-пропільну групу, ⁱPr представляє і-пропільну групу, ^cPr представляє циклопропільну групу, ⁿBu представляє н-бутильну групу, ^tBu представляє т-бутильну групу, Ph представляє фенільну групу, Bn представляє бензильну групу і Tos представляє толуолсульфонільну групу. ¹H-ЯМР сполук з таблиць також показано в Таблиці 29 - Таблиці 41.

Таблиця 1

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
1	-	=O		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	75-76
2	-	=O		-H	H	H	H	CH	-O-	76-79
3	-	=O		-OEt	H	H	H	CH	-O-	аморфна
4	-	=O		-OEt	H	H	H	CF	-O-	72-74
5	-	=O		-OEt	H	H	F	CH	-O-	аморфна
6	-	=O		-OEt	H	F	H	CH	-O-	93-95
7	-	=O		-OEt	F	H	H	CH	-O-	аморфна
8	8-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-O-	аморфна
9	-	-F	-F	-F	H	H	H	CH	-O-	аморфна
10	8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
11	-	=O		- ^t Bu	H	H	H	CH	-O-	аморфна
12	8-F	=O		- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	аморфна
13	-	-F	-F	-F	H	H	H	N	-O-	аморфна
14	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	77-79
16	-	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂		H	H	CH	-O-	90-94

Таблиця 2

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
17	-	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
18	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
19	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂		H	H	CH	-O-	104-106
20	-	=O		-NH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	168-188
21	-	=O		-NH ₂	Br	H	H	CH	-O-	204-206
22	-	=O		-N(CH ₃) ₂	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
23	-	-N-OH		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	125-126
24	-	=N-OCH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
25	-	=N-O ^t Bu		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
26	8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	171-173
27	-	-OCH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
28	-	-OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
29	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	153-160
30	8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	аморфна
31	-	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	H	CH	-O-	аморфна
32	-	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	129-131
33	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	122-124
34	8-F	-OH	-CH ₃	-(CH ₂) ₂		H	H	CH	-O-	аморфна
35	8-F	-OH	- ^t Bu	-(CH ₂) ₂		H	H	CH	-O-	аморфна
36	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
37	2-CH ₃ ,8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
38	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна

39	2- ^t Bu	=O		-H	H	H	H	CH	-O-	аморфна
40	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CF	-O-	аморфна
41	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	F	CH	-O-	аморфна
42	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 3

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
43	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
44	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	120-130
45	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	N	-O-	146-147
46	2-Et	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
47	2- ⁿ Bu	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
48	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	аморфна
49	8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
50	-	=O		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	CH	-NH-	130-132
51	-	=O		-Ph	H	H	H	CH	-NH-	аморфна
52	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	108-111
53	8-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	аморфна
54	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH(OH)-	173-175
55	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ^t Bu	H	H	H	CH	-CH(OH)-	140-143
56	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-CH(OH)-	136-130
57	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	182-183
58	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ^t Bu	H	H	H	CH	-CO-	105-108
59	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ O-Tos	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
60	2-CL	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	CH	-O-	аморфна
61	¹ -оксид, 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
62	-	≡N			H	H	H	CH	-O-	92-95
63	-	≡N			F	H	H	CH	-O-	149-151
64	-	≡N			Br	H	H	CH	-O-	167-169
65	-	≡N			CL	H	H	CH	-O-	150-151
66	-	≡N			OMe	H	H	CH	-O-	120-122

Таблиця 4

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
67	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
68	2- ⁱ Pr	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
69	2-OCH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
70	2-OEt	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
71	1-оксид	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	154-155
72	-	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
73	-	-OH	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
74	8-F	-OH	-CH ₃	-Ph	F	H	H	CH	-O-	аморфна
75	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	аморфна
76	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
77	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
78	2-CH=CH ₂ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
79	2-CH ₂ CH=CH ₂ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
80	8-F	-OH	-CH ₃	- ⁱ Pr	F	H	H	CH	-O-	аморфна
81	8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна

82	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	CH	-O-	аморфна
83	8-F	-OH	-CH ₃	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
84	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	149-150
85	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	111-113
86	8-F	-OH	-CH ₃	- ⁴ Pr	F	H	H	CH	-O-	аморфна
87	2- ⁴ Pr, 8-F	-OH	-CH ₃	- ⁴ Pr	F	H	H	CH	-O-	аморфна
88	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	аморфна
89	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	аморфна
90	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ⁴ Pr	F	H	H	CH	-O-	аморфна
91	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-CH ₃ OPh)	F	H	H	OH	-O-	аморфна
92	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 5

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
93	2-CH ₃ , 8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-98
94	2,8-(CH ₂) ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
95	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	120-123
96	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	Cl	H	H	CH	-O-	39-42
97	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
98	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	107-110
99	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	Cl	H	CH	-O-	124-126
100	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	93-94
101	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	CH ₃	H	CH	-O-	аморфна
102	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	135-137
103	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
104	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	CH	-O-	122-124
105	2-CH ₃ , 6-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
106	2-CH ₃ , 7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	98-100
107	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
108	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
100	-	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	93-94
110	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	138-140
111	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
112	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	170-172
113	-	-OSi(OH ₃) ₃	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
114	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	130-132
115	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	115-116
116	5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	154-155
117	2-CH ₃ , 5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	124-126
110	2-CH ₃ , 7-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 6

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
119	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	F	H	CH	-O-	аморфна
120	5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	90-92
121	2-CH ₃ , 5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	95-97
122	8-F	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	151-153
123	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	-CH ₃	H	CH	-O-	118-120
124	7,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	78-80
125	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	108-110
126	7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
127	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	130-132

128	2-CH ₃ , 7-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,7} 1,5580
129	8-F	- OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CN	F	H	H	CH	-O-	
130	8-F	-OH	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
131	-	-OCH ₃	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	аморфна
132	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
133	-	-OEt	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	аморфна
134	-	- ⁿ Pr	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	аморфна
135	-	- ^t Bu	-H	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
136	-	-CH	-H	- ^t Bu	H	H	H	CH	-O-	аморфна
137	-	-OH	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	аморфна
138	8-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	149-151
139	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	104-106
140	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
141	8-F	-OH	-H	-CH ₃	CL	F	H	CH	-O-	139-141
142	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CL	F	H	CH	-O-	аморфна
143	8-F	-OH	-H	- ⁴ Pr	CL	H	H	CH	-O-	аморфна
144	8-F	-OH	-H	- C(CH ₃)=CH ₂	CL	H	H	CH	-O-	103-104

Таблиця 7

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
145	8-F	-OH	-H	- ^t Bu	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
145	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
147	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
14B	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
149	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
150	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
151	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	112-114
152	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
153	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CN	H	H	CH	-O-	аморфна
154	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
155	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
156	8-F	-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
157	8-F	-OH	-H	-Et	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
158	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CF ₃	Cl	H	H	CH	-O-	115-117
159	8-F	-OH	-H	-CF ₃	Cl	H	H	CH	-O-	174-176
160	8-F	-OCH ₂ Ph	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
161	8-F	-OH	-H	-Ph	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
162	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	98-100
163	8-F	-OH	-H	- ⁿ Bu	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
164	8-F	-OH	-H	-C≡CH	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
165	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
166	8-F	-OH	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	CH	-O-	112-114
167	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	CH	-O-	аморфна
168	8-F	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
169	8-F	-OH	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	174-175
170	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 8

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
171	8-F	-OH	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
172	8-F	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
173	8-F	-OH	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
174	8-F	-OH	-H	-CH ₃ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
175	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
176	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	148-150
177	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	аморфна
178	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	130-131
179	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	119-121
180	8-F	-OCH ₃	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
181	8-F	-OH	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
182	8-F	-OH	-H	-CH ₃ CN	Cl	H	H	CH	-O-	123-125
183	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	124-126
184	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	106-110
185	8-F	-OH	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
186	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
187	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	77-80
188	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
189	-	-OH	-H	-CH ₃	H	H	H	CF	-O-	аморфна
190	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CF	-O-	аморфна
191	-	-OH	-H	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	157-159
192	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	133-135
193	-	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	129-131
194	5,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	115-116
195	5-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	114-115
196	8-F	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	100-101

Таблиця 9

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
197	7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	99-102
198	7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
199	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	135-136
200	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	127-129
201	7-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	92-94
202	2-CH ₃ , 7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	98-100
208	7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
204	8-F	-OH	-H	-C(=N-OCH ₃)- CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
206	8-F	-OH	-H	-CH ₃	I	H	H	CH	-O-	116-118
206	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
207	8-F	-N(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,3} 1,5836
206	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	I	H	H	CH	-O-	61-63
208	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна

210	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	COCH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
211	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SCH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
212	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
213	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCH ₃	H	H	CH	-O-	
214	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	¹⁴ Pr	H	H	CH	-O-	
215	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Ph	H	H	CH	-O-	аморфна
216	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	N(CH ₃) ₂	H	H	CH	-O-	
217	8-F	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
218	8-F	-OEt	-H	-OEt	F	H	H	CH	-O-	аморфна
219	8-F	-OH	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	141-143
220	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
221	8-F	$\begin{array}{c} - \\ \text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \end{array}$	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
222	8-F	-OH	-H	-H	Br	H	H	CH	-O-	142-144

Таблиця 10

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
223	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
224	8-F	-NH- ^H Bu	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
225	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
226	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ O-Tos	H	H	H	CH	-O-	аморфна
227	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
228	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	106-108
229	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CHO	H	H	H	CH	-O-	121-123
230	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
231	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH=N-OH	H	H	H	CH	-O-	158-169
232	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CN	H	H	H	CH	-O-	аморфна
233	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -COCH ₃	H	H	H	CH	-O-	107-109
234	-	-CH ₃	-CH ₃	-CHO	H	H	H	CH	-O-	аморфна
235	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
236	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	130-131
237	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	136-138
238	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CHO	H	H	H	CH	-O-	140-149
239	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CHO	F	H	H	CH	-O-	156-158
240	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	147-148
241	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
242	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	120-122
243	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
244	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
245	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CHO	H	H	H	CH	-O-	93-96
246	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
247	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	аморфна
248	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ CH(OCH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 11

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
249	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CO ₂ H	H	H	H	CH	-O-	181-184
250	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CO ₂ CH ₃	H	H	H	CH	-O-	123-125
251	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
252	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
253	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
254	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
255	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)-C(CH ₃)=CH ₂	H	H	H	CH	-O-	аморфна
256	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
257	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -COCH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
258	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
259	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	аморфна
260	-	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
261	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
262	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
263	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
264	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	139-141
265	-	CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
266	7-F	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
267	7,8-F ₂	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
268	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
269	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
270	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
271	-	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	аморфна
272	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	126-128
273	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CONH ₂	H	H	H	CH	-O-	172-175
274	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	164-166

Таблиця 12

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
275	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	175-177
276	-	-H	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	96-93
277	-	-H	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна
278	-	-H	-CH ₃	- ⁱ Pr	H	H	H	CH	-O-	аморфна
270	-	-H	-CH ₃	- ⁿ Bu	H	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,5} 1,6215
280	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
281	-	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	131-132
282	-	-H	-H	-H	H	H	H	CH	-O-	46-4В
283	-	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	74-75
284	8-F	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	82-63
285	-	-CH=CH-CH=CH-			H	H	H	CH	-O-	105-106
286	-	-(CH ₂) ₄ -			H	H	H	CH	-O-	аморфна
287	-	-(CH ₂) ₃ -			H	H	H	CH	-O-	68-70
286	-	-CH=CH-CH ₂ CH ₂ -			H	H	H	CH	-O-	67-59
289	-	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	106-109
290	-	-F	-F	-CH ₃ OH	F	H	H	CH	-O-	129-131
291	-	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	99-101
292	8-F	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,4} 1,5400
293	8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	114-116

294	8-F	-F	-F	-COCH ₃		H	H	CH	-O-	60-63
295	8-F	-F	-F	-CON(CH ₃)OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
296	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	104-106
297	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	аморфна
298	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	128-130
299	-	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	91-93
300	-	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	123-124

Таблиця 13

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
301	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	Cl	H	H	CH	-O-	
302	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	Cl	H	H	CH	-O-	
308	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
304	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
305	-	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	72-74
306	2-Cl	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	аморфна
307	2-OH	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	135-139
308	8-F	-O-CH ₂ -		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
309	-	-(CH ₂) ₄ -		-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	86-68
310	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	142-144
311	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	132-134
312	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
313	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
314	2-CH ₃ , 8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	168-170
315	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	155-158
316	8-F	=N-OH		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	145-147
317	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	199-202
318	2-CH ₃ , 7-F	=N-OCH ₃		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,6} 1,5712
319	2-CH ₃ , 7-F	=N-OEt		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,6} 1,5629
320	-	=N-O ^t Bu		-H	F	H	H	CH	-O-	106-107
321	8-F	≡N			F	H	H	CH	-O-	184-185
322	-	Ph			H	H	H	CH	-O-	85-86
323	-	-OH	CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CH ₂ -	148-149
324	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	114-116
325	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	159-161
326	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-CH ₂ -	115-117

Таблиця 14

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
327	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	151 -153
328	8-F	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	аморфна
329	8-F	=O		-OEt	H	H	H	CH	-CH ₂ -	аморфна
330	-	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₃ -	аморфна
331	7-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	в'язке масло
332	8-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	111-112
333	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CO-	192-193
334	-	-OH	-H	-CH=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
335	8-F	=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	43-45
336	-	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	H	H	H	CH	-CO-	134-136
337	-	=CH ₂		-H	H	H	H	CH	-CO-	92-95
338	-	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	125-128
339	-	=C(CH ₃) ₂		-H	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
340	-	-CH=CH-CH=CH-				H	H	CH	-CO-	в'язке масло
341	8-F	=O		-H	F	H	H	CH	-CO-	179-181

342	-	=O		-H	H	H	H	CH	-CO-	120-122
343	-	=O		-CH=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
344	8-F	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
345	-	-H	-H	-CH ₂ -N ₃	H	H	H	CH	-CO-	аморфна
346	-	-H	-H	-Ph	CL	H	H	CH	-CO-	115-117
347	-	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-CO-	аморфна
348	8-F	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-CO-	89-92
349	8-F	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	F	H	H	CH	-CH(OH)-	159-161
350	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CH(OH)-	аморфна
351	-	=CH ₂		-H	H	H	H	CH	*1	аморфна
352	-	=O		-CO ₂ Et	H	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 15

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
353	8-F	=O	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
354	8-F	=O	-CH ₃	*2	H	H	CH	-O-	-O-	146-148
355	8-F	=O	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
356	8-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	-O-	103-104
357	8-F	=O	*3	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
358	2-CH ₃ , 8-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	96-100
359	2-CH ₃ , 8-F	=O	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
360	2-CH ₃ , 8-F	=O	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
361	8-F	=O	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	-O-	аморфна
362	2,4-(CH ₃) ₂ , 8-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	164-65
363	8-F	=O	- ¹³ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
364	8-F	=O	-C(CH ₃)=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
365	8-F	=O	- ^t Bu	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
366	2-CH ₃ , 8-Cl	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	100-102
367	2,8-(CH ₃) ₂	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
368	8-F	=O	-Ph	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
369	8-F	=O	-CH=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	77-79
370	8-F	=O	-C≡CH	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	121-123
371	8-F	=O	- ⁿ Bu	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
372	8-F	=O	-CH ₂ Cl	F	H	H	CH	-O-	-O-	113-116
373	8-F	=O	-CHCl ₂	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
374	8-F	=O	-CCl ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
375	8-F	=O	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
376	8-F	=O	-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
377	8-F	=O	- ⁱ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
378	8-F	=O	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	-O-	132-135

Таблиця 16

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
379	2-CH ₃ , 8-F	=O	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	-O-	126-128
380	2-CH ₃ , 8-F	=O	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	-O-	126-128
381	-	=O	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	-O-	38-40
382	2-CH ₃ , 6-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
383	2-CH ₃ , 7-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
384	8-F	=O	-CH ₂ O-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
385	-	=O	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	100-104
386	-	=O	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	-O-	112-124
387	5,8-F ₂	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	45-48
388	5-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна
389	2-CH ₃ , 7-Cl	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	-O-	аморфна

390	8-F	=O	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
391	7,8-F ₂	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	128-130
392	7,8-F ₂	=O	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	106-107
393	2-CH ₃ , 8-F	=O	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	113-114
394	7-F	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	97-99
395	2-CH ₃ , 8-F	=O	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	169-170
396	8-F	=O	-COCH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-98
397	2-CH ₃ , 8-F	=O	-C(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
398	8-F	=O	-C(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
399	8-F	=O	-C(=N-OCH ₃)-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	118-119
400	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	155-156
401	-	=O	-NHPh	H	H	H	CH	-O-	аморфна
402	-	=O	-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
403	-	=O	-OCH ₃	Br	H	H	CH	-O-	аморфна
404	8-F	=O	-OEt	H	Cl	H	CH	-O-	88-90

Таблиця 17

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
405	8-F	=O		-OEt	H	CH ₃	H	CH	-O-	88-90
406	8-F	=O		-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,6} 1,6008
407	8-F	=O		-O ⁱ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,7} 1,5809
406	8-F	=O		-O-CH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	114-116
408	8-F	=O		-OEt	F	CH ₃	H	CH	-O-	аморфна
410	8-F	=O		-O ^t Bu	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
411	8-F	=O		-O-C(CH ₃) ₂ -CO ₂ Et	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ^{22,4} 1,5411
412	8-F	=O		-H	Cl	F	H	CH	-O-	153-155
413	8-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	133-135
414	8-F	=O		-H	Br	H	H	CH	-O-	111-114
415	8-F	=O		-H	Bn	H	H	CH	-O-	92-94
416	8-F	=O		-H	NO ₂	H	H	CH	-O-	106-109
417	8-F	=O		-H	Br	F	H	CH	-O-	140-142
418	8-F	=O		-H	CF ₃	H	H	CH	-O-	125-127
419	-	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	82-85
420	-	=O		-H	Cl	F	H	CH	-O-	136-138
421	5,8-F ₂	=O		-H	F	H	H	CH	-O-	118-121
422	5-F	=O		-H	F	H	H	CH	-O-	92-94
423	7,8-Fe	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	142-144
424	7-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	122-123
425	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	110-112
426	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OH	F	H	H	CH	-O-	163-165
427	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
428	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-C(CH ₃)(Et)OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
429	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₂ -OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	141-143
430	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	аморфна

Таблиця 18

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
431	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	аморфна
432	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	F	H	H	CH	-O-	110-112
433	8-F	-NHCO ₂ ^t Bu	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	127-129
434	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-NHCO ₂ ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	132-134
435	8-F	-NH ₂	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
436	8-F	-NHCOCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	144-146
437	8-F	-NHCOCF ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	аморфна
438	-	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	H	H	H	CH	-CH(OH)-	80-63
439	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	97-98
440	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	94-95
441	2-CH ₃ , 7-F	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	104-105
442	8-F	-N(CH ₃) ₂	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
443	8-F	-NHCOCH ₃	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна
444	8-F	-N(Bn)COCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	195-197
445	8-F	Піролідин-1-іл	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ^{20,5} 1,5593
446	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NHCO ₂ ^t Bu	H	H	CH	-O-	аморфна
447	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NH ₂	H	H	CH	-O-	аморфна
448	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NHCH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
449	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	138-141
450	7,8-F ₂	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	157-160
451	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	172-175

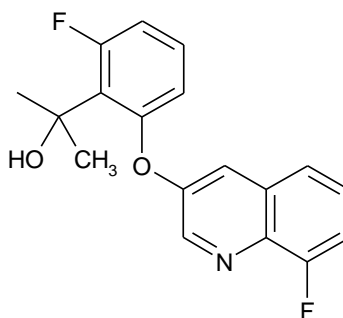
Таблиця 19

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
452	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	150-152
453	8-F	-CH ₃	-H	-SO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	аморфна

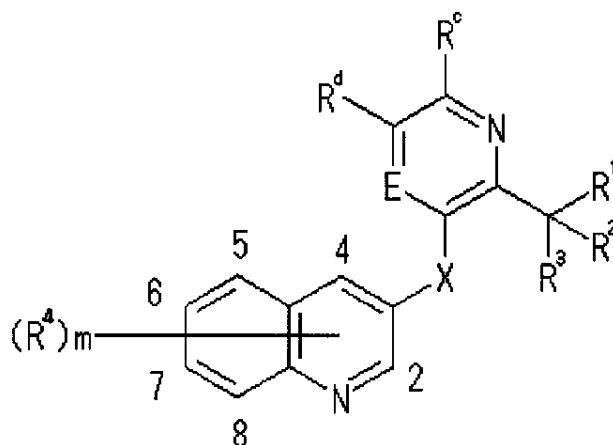
*1 = "-C(=N-CH₂CH=CH₂)-"

*2 = "8-Фторхінолін-3-ілокси"

*3 =

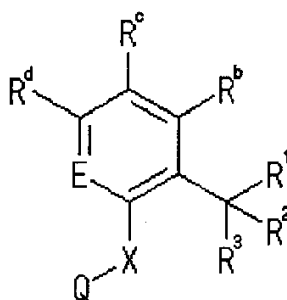


Таблиця 20

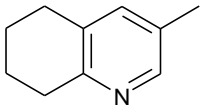
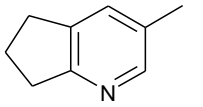
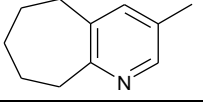
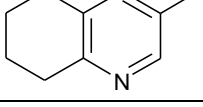


Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
a-1	-	≡N			H	H	CH	-O-	149-150
a-2	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
a-3	8-F	=O		-H	H	H	CH	-O-	138-140
a-4	2- ^t Bu, 8-F	=O		-H	H	H	CH	-O-	150-151
a-5	8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	CH	-O-	110-112
a-6	8-F	=O		- ^t Bu	H	H	CH	-O-	90-91
a-7	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
a-8	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	аморфна
a-9	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	H	H	CH	-O-	133-134
a-10	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	CH	-O-	133-136
a-11	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	CH	-O-	
a-12	8-F	CH ₃	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	CH	-O-	
a-13	8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-14	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	COCH ₃	H	H	CH	-O-	

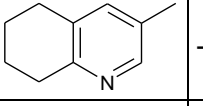
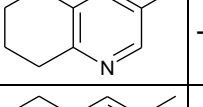
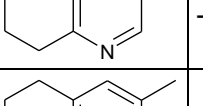
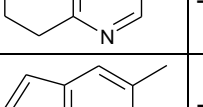
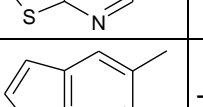
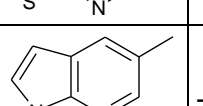
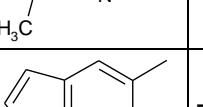
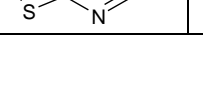
Таблиця 21



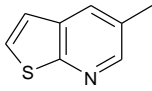
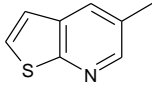
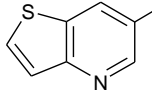
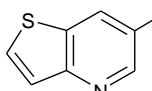
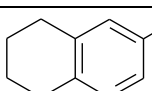
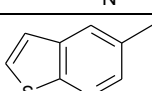
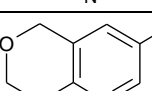
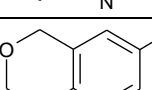
Сполука №	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
b-1		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-2		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	133-135

b-3		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-4		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-5		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-6		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло

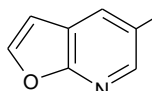
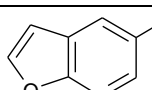
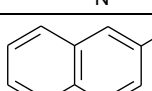
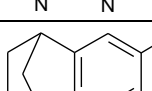
Таблиця 22

Сполука №	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
b-7		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-8		-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-9		-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-10		-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-11		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-12		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-13		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-14		-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло

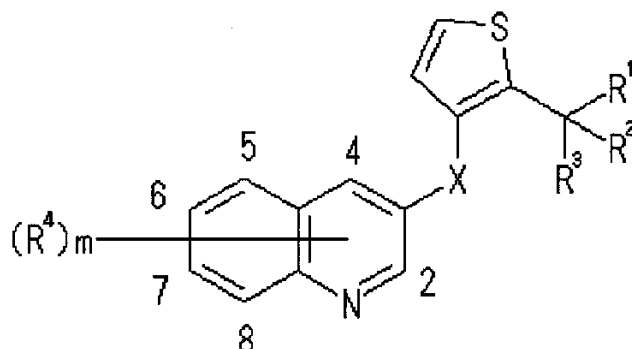
Таблиця 23

Сполука №	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
b-15		-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-16		-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	аморфна
b-17		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	76-60
b-18		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	101 -102
b-19		=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	в'язке масло
b-20		=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	аморфна
b-21		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-22		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло

Таблиця 24

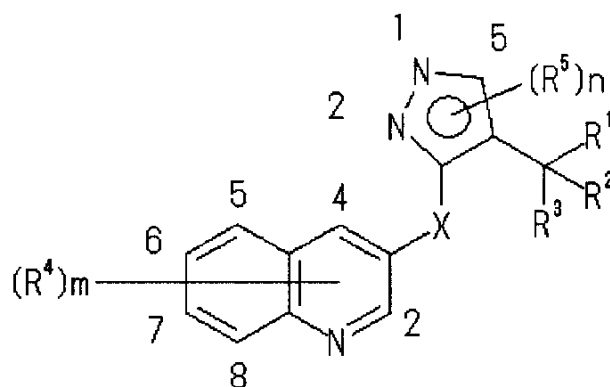
Сполука №	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Фізичні властивості
b-23		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	в'язке масло
b-24		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	87-69
b-25		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	
b-26		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	

Таблиця 25



Сполука №	$(R^4)_m$	R^1	R^2	R^3	-X-	Фізичні властивості
c-1	8-F	=O		-OCH ₃	-O-	
c-2	8-F	=O		-H	-O-	135-137
c-3	8-F	=O		-CH ₃	-O-	138-139
c-4	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	-O-	129-131
c-5	8-F	-OH	-H	-CH ₃	-O-	96-98

Таблиця 26



Сполука №	$(R^4)_m$	R^1	R^2	R^3	$(R^5)_n$	-X-	Фізичні властивості
d-1	8-F	=O		-OCH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-2	8-F	=O		-H	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-3	8-F	=O		-CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-4	8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	160-162
d-5	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	$n_D^{20,6}$ 1,5056
d-6	8-F	-OH	-H	- ¹ Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-7	8-F	-OH	-H	- ¹⁴ Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-8	8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-9	8-F	-OH	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-10	8-F	-OH	-H	-C(CH ₂) ₂ -COCH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-11	8-F	-OH	-H	-C(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	

Таблиця 27

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	-X-	Фізичні властивості
d-12	8-F	-OH	-H	-CH ₃ Ph	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-13	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-14	8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-15	8-F	-OH	-H	-COCH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-16	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-17	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ¹ Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-18	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ¹³ Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-19	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-20	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-21	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-22	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-23	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-24	8-F	-OH	-CH ₃	- ¹ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-25	8-F	-OH	-CH ₃	- ¹³ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-26	8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-27	8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-28	8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₂) ₂ -COCH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-29	8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-30	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-31	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-32	8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-33	8-F	-OH	-CH ₃	-COCH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-34	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-35	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ¹ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	

Таблиця 28

Сполука №	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	-X-	Фізичні властивості
d-36	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ¹³ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-37	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-38	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-39	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-40	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	

Таблиця 29

Сполука №	¹ H-ЯМР
3	1,16(т, 3H), 4,23(к, 2H), 7,13(д, 1H), 7,29-7,64(м, 6H), 8,02(м, 1H), 8,08(д, 1H), 8,83(д, 1H).
5	1,19(т, 3H), 4,24(к, 2H), 6,80(м, 1H), 7,01 (м, 1 H), 7,43(д, 1H), 7,50-7,71 (м, 3H), 8,04-8,16(м, 2H), 8,83(ш, 1H)
7	1,22(т, 3H), 4,31 (к, 2H), 6,79(д, 1H), 6,99(т, 1H), 7,38(м,1H), 7,51 -7,72(м, 4H), 8,11 (д, 1H), 8,81 (д, 1H)
8	1,20(т, 3H), 4,32(к, 2H), 6,85 (д, 1H), 7,03(т, 1H), 7,30-7,54(м, 5H), 8,85(д, 1H).
9	7,03(д, 1H), 7,27 (д, 1H), 7,30-7,77(м, 6H), 8,12(д, 1H), 8,81 (д, 1H).
10	2,61 (с, 3H), 6,79(м, 1H), 7,01 (т, 1H), 7,31 -7,43(м, 2H), 7,47-7,50(м, 2H), 7,58(м, 1H), 8,83(д, 1H).
11	1,28(с, 9H), 6,97(д, 1H), 7,17-7,26(м, 2H), 7,26(м, 1H), 7,52(т, 1H), 7,56(д, 1H), 7,63(м, 1H), 7,69(д, 1H), 8,09(д, 1H), 8,77(д, 1H).
12	1,28(с, 9H), 6,76(д, 1H), 6,98(т, 1H), 7,27-7,50(м, 4H), 7,59(м, 1H), 8,87(д, 1H).
13	7,13(м, 1H), 7,54(м, 1H), 7,69(м, 1H), 7,79(м, 1H), 7,96-8,04(м, 2H), 8,1 4(д, 1H), 8,25(ш, 1H), 8,83(д, 1H).

14	1,35(д, 9H), 6,82(д, 1H), 7,03-7,14(м, 2H), 7,38-7,56(м, 5H), 8,02(д, 1H), 8,73(с, 1H).
17	0,71 (т, 3H), 1 39(с, 6H), 1,84(к, 2H), 6,90(м, 1H), 7,1 2-7,23(м, 2H), 7,41 (д, 1H), 7,43-7,68(м, 4H), 8,10 (д, 1H), 8,80(ш, 1H).
18	0,66(т, 3H), 1,37(с, 6H), 1,85 (к, 2H), 6,64(д, 1H), 6,84-6,93(м, 2H), 7,07(м, 1H), 7,15-7,26(м, 2H), 7,41 -7,47(м, 2H), 8,82 (д, 1H).
22	2,98(с, 3H), 3,1 2(с, 3H), 6,88(д, 1H), 7,20(т, 1H), 7,41 (д, 1H), 7,54 (т, 1H), 7,63-7,73 (м, 3H), 8,10(д, 1H), 8,79(д, 1H).
24	2,19(с, 3H), 3,89(с, 3H), 7,03(д, 1H), 7,26(м, 1H), 7,36-7,43(м, 2H), 7,48-7,55(м, 2H), 7,59-7,67(м, 2H), 8,06(д, 1H), 8,81 (д, 1H).
25	1,18(с, 9H), 2,18(с, 3H), 7,05(д, 1H), 7,26(м, 1H), 7,35-7,64(м, 6H), 8,08(д, 1H), 8,80(д, 1H)
27	1,73(с, 3H), 3,1 7(с, 6H), 6,98(д, 1H), 7,19(т, 1H), 7,29(м, 1H), 7,48-7,68(м, 4H), 7,82(дд, 1H), 8,08(д, 1H), 8,79(д, 1H)
28	0,20(с, 9H), 1,76(д, 1H), 4,57(ш, 1H), 6,62(д, 1H), 6,92(м, 1H), 7,15(м, 1H), 7,33(м, 1H), 7,33(м, 1H), 7,46-7,51 (м, 2H), 7,70(с, 1H), 8,83(ш, 1H).
30	1,06(с, 9H), 1 76(д, 1H), 4,57(ш, 1H), 6,62(д, 1H), 6,92(м, 1H), 7,15(м, 1H), 7,33(м, 1H), 7,46-7,51 (м, 2H), 7,70(с, 1H), 8,83(ш, 1H).
31	1,08(с, 9H), 1,60(с, 1H), 1,68(с, 3H), 6,86(м, 1H), 7,13-7,24(м, 2H), 7,51 -7,71 (м, 5H), 8,11 (д, 1H), 8,79(д, 1H).
34	1,70(с, 3H), 2,22-2,37(м, 2H), 2,43(ш, 1H), 2,91 (м, 1H), 3,08 (м, 1H), 6,72(д, 1H), 7,07(д, 1H), 7,24(т, 1H), 7,32(м, 1H), 7,45-7,49(м, 2H), 7,59(м, 1H), 8,88(д, 1H).
35	1 07(с, 9H), 2,1 3(м, 1H), 2,65(м, 1H), 2,93-2,99(м, 3H), 6,69(д, 1H), 7,03(д, 1H), 7,19(т, 1H), 7,33(м, 1H), 7,45-7,52(м, 2H), 7,67(м, 1H), 8,85(д, 1H).

Таблица 30

Сполука №	¹ H-ЯМР
36	1,75(д, 6H), 3,79(д, 1H), 6,69(м, 1H), 6,95(м, 1H), 7,20(м, 1H), 7,35(м, 1H), 7,45-7,51 (м, 2H), 7,59(д, 1H), 8,83(д, 1H).
37	1,76(д, 6H), 2,80(с, 3H), 3,87(ш, 1H), 6,58(д, 1H), 6,93(м, 1H), 7,19(м, 1H), 7,29-7,45(м, 4H).
38	1 70(с, 6H), 3,01 (ш, 1H), 6,87(д, 1H), 7,15-7,25(м, 2H), 7,54(т, 1H), 7,60-7,71 (м, 4H), 8,12(д, 1H), 8,81 (д, 1H).
39	1,28(с, 9H), 7,03(с, 1H), 7,36(д, 1H), 7,52-7,72(м, 4H), 7,95(д, 1H), 8,13(д, 1H), 8,87(д, 1H), 10,42(с, 1H).
40	1,64(с, 6H), 2,53(с, 1H), 7,12(м, 1H), 7,21 -7,32(м, 2H), 7,50-7,67(м, 4H), 8,11 (д, 1H), 8,85(д, 1H).
41	1,70(с, 6H), 2,77(с, 1H), 6,56(м, 1H), 6,86(м, 1H), 7,54-7,75(м, 5H), 8,13(д, 1H), 8,80(д, 1H).
42	1,68(с, 6H), 2,88(с, 1H), 6,84-6,97(м, 2H), 7,44(м, 1H), 7,52-7,57(м, 2H), 7,62-7,71 (м, 2H), 8,12(д, 1H), 8,79(д, 1H).
43	1,77(д, 6H), 4,00(д, 1H), 6,66(м, 1H), 6,90(м, 1H), 8,18(м, 1H), 8,53-7,73(м, 4H), 8,12(д, 1H), 8,79(д, 1H).
46	1,43(т, 3H), 1,72(с, 6H), 2,95(с, 1H), 3,14(к, 2H), 6,80(д, 1H), 7,16-7,25(м, 2H), 7,43-7,48(м, 2H), 7,60-7,67(м, 3H), 8,07(д, 1H).
47	0,94(т, 3H), 1,16(м, 2H), 1,72(с, 6H), 1,87(м, 2H), 2,92(с, 1H), 3,10(т, 2H), 6,81 (д, 1H), 7,14-7,23(м, 2H), 7,43-7,48(м, 2H), 7,59-7,67(м, 3H), 8,07(д, 1H).
48	0,93(т, 3H), 1,72(д, 3H), 1,95(м, 1H), 2,08(м, 1H), 3,87(д, 1H), 6,68(д, 1H), 6,95(м, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,36(м, 1H), 7,44-7,51 (м, 2H), 7,59(м, 1H), 8,82(д, 1H).
49	1,75(д, 6H), 3,76(д, 1H), 6,69(м, 1H), 6,94(м, 1H), 7,20(м, 1H), 7,47(м, 1H), 7,59-7,66(м, 2H), 7,78(дд, 1H), 8,90(д, 1H).
51	6,81-6,84(м, 1H), 7,39-7,64(м, 8H), 7,72-7,76(м, 3H), 7,99(д, 1H), 8,07(д, 1H), 8,89(д, 1H), 10,29(с, 1H).
53	1,19(т, 3H), 4,25(к, 2H), 4,31 (с, 2H), 7,04(д, 1H), 7,32-7,53(м, 5H), 7,86(с, 1H), 8,84(д, 1H).
59	0,94(с, 6H), 1,26(с, 6H), 2,45(с, 3H), 3,91 (с, 2H), 7,03(м, 1H), 7,28-7,37(м, 3H), 7,40(м, 1H), 7,53(д, 1H), 7,61 (т, 1H), 7,80-7,88(м, 4H), 8,16(д, 1H), 8,40(д, 1H), 9,27(д, 1H).
60	1,37(с, 6H), 1,98(т, 1H), 2,98(т, 1H), 6,72(д, 1H), 7,06(д, 1H), 7,17(т, 1H), 7,47-7,65(м, 3H), 8,02(дд, 1H).
61	6,96(м, 1H), 7,16-7,32(м, 2H), 7,39-7,49(м, 3H), 7,57(м, 1H), 7,99(д, 1H), 8,45(ш, 1H).

67	1,72 (с, 6H), 2,77 (с, 3H), 3,01 (ш, 1H), 6,79 (д, 1H), 7,13-7,25 (м, 2H), 7,43-7,49 (м, 2H), 7,59-7,67 (м, 3H), 8,05 (д, 1H).
68	1,43 (д, 6H), 1,73 (с, 6H), 3,01 (с, 1H), 3,64 (м, 1H), 6,78 (д, 1H), 7,12-7,25 (м, 2H), 7,41-7,46 (м, 2H), 7,58-7,65 (м, 3H), 8,08 (д, 1H).
69	1,70 (с, 3H), 3,57 (с, 1H), 4,11 (с, 3H), 6,83 (д, 1H), 7,11-7,23 (м, 2H), 7,38 (т, 1H), 7,54-7,62 (м, 4H), 7,88 (д, 1H).

Таблица 31

Сполука №	¹ H-ЯМР
70	1,35 (т, 3H), 1,71 (с, 6H), 3,61 (с, 1H), 4,56 (а 2H), 6,84 (д, 1H), 7,11-7,20 (м, 2H), 7,39 (т, 1H), 7,53-7,63 (м, 4H), 7,85 (д, 1H).
72	1,26 (с, 3H), 1,36 (с, 3H), 1,76 (с, 3H), 2,17 (с, 1H), 4,01 (с, 1H), 6,89 (д, 1H), 7,17-7,28 (м, 2H), 7,54 (т, 1H), 7,60-7,71 (м, 4H), 8,11 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).
73	1,15 (т, 3H), 1,86 (с, 3H), 3,80 (с, 1H), 3,94-4,06 (м, 2H), 6,95 (д, 1H), 7,23-7,37 (м, 2H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,61-7,71 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,72 (д, 1H).
74	2,04 (с, 3H), 4,27 (с, 1H), 6,60 (д, 1H), 6,94-7,04 (м, 3H), 7,10-7,46 (м, 8H), 8,31 (д, 1H).
75	1,84 (д, 3H), 3,12 (д, 1H), 3,36 (д, 1H), 4,17 (д, 1H), 6,50 (д, 1H), 6,89-7,50 (м, 11H), 8,51 (д, 1H).
76	1,83 (д, 3H), 3,92 (д, 1H), 5,01 (д, 1H), 5,16 (д, 1H), 6,25 (дд, 1H), 6,69 (д, 1H), 6,95 (дд, 1H), 7,22 (м, 1H), 7,33 (м, 1H), 7,47-7,50 (м, 2H), 7,56 (д, 1H), 8,76 (д, 1H).
77	1,74 (д, 3H), 2,62 (м, 1H), 2,89 (м, 1H), 3,87 (д, 1H), 5,10 (д, 1H), 5,78 (м, 1H), 6,69 (д, 1H), 6,94 (дд, 1H), 7,19 (м, 1H), 7,33 (м, 1H), 7,48-4,50 (м, 2H), 7,58 (д, 1H), 8,82 (д, 1H).
78	1,84 (д, 3H), 3,97 (д, 1H), 5,03 (д, 1H), 5,17 (д, 1H), 5,71 (дд, 1H), 6,27 (дд, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,76 (дд, 1H), 6,93 (дд, 1H), 7,16-7,42 (м, 5H), 7,46 (д, 1H).
79	1,73 (д, 3H), 2,62 (м, 1H), 2,86 (м, 1H), 3,89-3,95 (м, 3H), 5,07-5,20 (м, 4H), 5,82 (м, 1H), 6,18 (м, 1H), 6,64 (д, 1H), 6,94 (дд, 1H), 7,16-7,41 (м, 5H).
80	0,95 (д, 3H), 0,99 (д, 3H), 1,67 (д, 3H), 2,30 (м, 1H), 3,81 (д, 1H), 6,67 (д, 1H), 6,94 (м, 1H), 7,17 (м, 1H), 7,33 (м, 1H), 7,45-7,51 (м, 2H), 7,61 (д, 1H), 8,81 (д, 1H).
81	1,75 (с, 3H), 1,85 (д, 3H), 4,00 (д, 1H), 4,77 (с, 1H), 4,95 (с, 1H), 6,68 (д, 1H), 6,95 (м, 1H), 7,22 (м, 1H), 7,35 (м, 1H), 7,48-7,51 (м, 2H), 7,57 (д, 1H), 8,72 (д, 1H).
82	1,81 (д, 3H), 3,09 (д, 1H), 3,35 (д, 1H), 4,13 (с, 1H), 6,57 (д, 1H), 6,80-7,04 (м, 6H), 7,10-7,51 (м, 4H), 8,65 (д, 1H).
83	1,00 (д, 3H), 1,67-1,70 (м, 3H), 2,84 (т, 2/3H), 2,95 (т, 1/3H), 3,72 (д, 1/3H), 3,94 (д, 2/3H), 4,97-5,10 (м, 2H), 5,78-5,95 (м, 1H), 6,68 (д, 1H), 6,90-6,96 (м, 1H), 7,16-7,25 (м, 1H), 7,31-7,38 (м, 1H), 7,47-7,50 (м, 2H), 7,59-7,62 (м, 1H), 8,81-8,83 (м, 1H).
86	0,39-0,45 (м, 3H), 0,55 (м, 1H), 1,51 (дд, 1H), 1,73 (д, 3H), 3,74 (д, 1H), 6,68 (м, 1H), 6,95 (м, 1H), 7,22 (м, 1H), 7,35 (м, 1H), 7,47-7,50 (м, 2H), 7,59 (д, 1H), 8,82 (д, 1H).
87	0,40-0,51 (м, 3H), 0,59 (м, 1H), 1,00 (м, 2H), 1,38 (м, 2H), 1,55 (м, 1H), 1,76 (д, 3H), 2,54 (м, 1H), 4,08 (д, 1H), 6,62 (д, 1H), 6,91 (дд, 1H), 7,13-7,40 (м, 4H), 7,45 (с, 1H).
88	0,95 (т, 3H), 1,73 (д, 3H), 1,98 (м, 1H), 2,08 (м, 1H), 2,79 (с, 3H), 3,96 (д, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,92 (м, 1H), 7,19 (м, 1H), 7,29-7,46 (м, 4H).
89	1,74 (д, 3H), 2,76 (с, 3H), 3,99 (д, 1H), 5,02 (д, 1H), 5,18 (д, 1H), 6,28 (м, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,94 (м, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,29-7,42 (м, 4H).
90	0,39-0,47 (м, 3H), 0,58 (м, 1H), 1,50 (м, 1H), 1,74 (д, 3H), 2,80 (с, 3H), 3,85 (д, 1H), 6,59 (д, 1H), 6,95 (м, 1H), 7,18 (м, 1H), 7,28-7,46 (м, 4H).

Таблица 32

Сполука №	¹ H-ЯМР
91	1,83 (д, 3H), 2,63 (с, 3H), 3,06 (д, 1H), 3,30 (д, 1H), 3,67 (с, 3H), 4,21 (ш, 1H), 6,43 (д, 1H), 6,68 (д, 2H), 6,89-6,96 (м, 3H), 7,16 (м, 1H), 7,27-7,41 (м, 4H).
92	1,82 (д, 3H), 2,64 (с, 3H), 3,10 (д, 1H), 3,34 (д, 1H), 4,25 (ш, 1H), 6,45 (д, 1H), 6,81-7,02 (м, 6H), 7,17 (м, 1H), 7,26-7,42 (м, 3H).
94	1,78 (д, 6H), 2,74 (с, 3H), 2,81 (с, 3H), 4,23 (д, 1H), 6,52 (д, 1H), 6,86 (дд, 1H), 7,10 (м, 1H), 7,37 (т, 1H), 7,48-7,51 (м, 3H).

97	1,81 (с, 6H), 2,82 (с, 3H), 4,02 (с, 1H), 6,80 (дд, 1H), 7,17 (м, 1H), 7,26-7,32 (м, 3H), 7,37-7,40 (м, 2H).
101	1,68 (с, 6H), 2,40 (с, 3H), 6,82 (д, 1H), 7,07 (м, 1H), 7,2-7,6 (м, 5H), 8,86 (д, 1H).
108	1,82 (с, 6H), 4,12 (с, 1H), 6,86 (дд, 1H), 7,15 (м, 1H), 7,28 (м, 1H), 7,47-7,56 (м, 2H), 7,62-7,70 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,77 (д, 1H).
105	1,76 (д, 3H), 2,76 (с, 3H), 3,93 (д, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,92 (м, 1H), 7,1 3-7,27 (м, 2H), 7,35-7,42 (м, 2H), 8,02 (м, 1H).
107	1,78 (д, 6H), 2,75 (с, 3H), 6,55 (м, 1H), 6,89 (м, 1H), 7,14 (м, 1H), 7,4-7,7 (м, 4H), 8,06 (дд, 1H).
108	1,82 (с, 6H), 2,77 (с, 3H), 4,1 8 (с, 1H), 6,77 (дд, 1H), 7,13 (м, 1H), 7,25-7,35 (м, 2H), 7,46 (м, 1H), 7,59-7,64 (м, 2H), 8,04 (д, 1H).
111	2,62 (с, 3H), 6,75 (д, 1H), 6 96 (т, 1H), 7,36 (м, 1H), 7,55 (т, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,65-7,76 (м, 2H), 8,1 2 (д, 1H), 8,79 (д, 1H).
113	0,20 (с, 9H), 6,73 (д, 1H), 6,97 (м, 1H), 7,36 (м, 1H), 7,54-7,77 (м, 4H), 8,1 2 (д, 1H), 8,71 (д, 1H).
118	1,76 (д, 3H), 2,74 (с, 3H), 3,92 (д, 1H), 6,55 (м, 1H), 6,91 (м, 1H), 7,17 (м, 1H), 7,41-7,51 (м, 2H), 7,57 (д, 1H), 8,04 (д, 1H).
119	1,77 (д, 6H), 3,88 (д, 1H), 6,63 (м, 1H), 7,04 (м, 1H), 7,53-7,59 (м, 2H), 7,65-7,73 (м, 2H), 8,12 (д, 1H), 8,79 (д, 1H).
126	1,77 (д, 6H), 3,97 (д, 1H), 6,64 (м, 1H), 6,91 (м, 1H), 7,17 (дт, 1H), 7,36 (дт, 1H), 7,63 (д, 1H), 7,68-7,77 (м, 2H), 8,80 (д, 1H).
131	2,17-2,25 (м, 2H), 2,83-2,93 (м, 1H), 3,16-3,27 (м, 1H), 3,33 (с, 3H), 4,88 (т, 1H), 6,84 (д, 1H), 7,1 4 (д, 1H), 7,30 (д, 1H), 7,48-7,54 (м, 2H), 7,59-7,68 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,85 (д, 1H).
132	1,44 (д, 3H), 3,25 (с, 3H), 4,73 (к, 1H), 6,96-6,99 (м, 1H), 7,26-7,33 (м, 2H), 7,41 (д, 1H), 7,51 (т, 1H), 7,58-7,66 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,82(д, 1H).
133	0,99 (т, 3H), 2,16-2,25 (м, 1H), 2,88-2,92 (м, 1H), 3,16-3,25 (м, 1H), 3,35-3,43 (м, 1H), 3,48-3,56 (м, 1H), 4,97 (дд, 1H), 6,87 (д, 1H), 7,13 (д, 1H), 7,29 (т, 1H), 7,46-7,52 (м, 2H), 7,58-7,67 (м, 2H), 8,09 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).
134	0,74 (т, 3H), 1,35-1,43 (м, 2H), 2,17-2,25 (м, 2H), 2,89 (м, 1H), 3,22 (м, 1H), 3,29 (м, 1H), 3,44 (м, 1H), 4,98 (м, 1H), 6,85 (д, 1H), 7,13 (д, 1H), 7,29 (т, 1H), 7,46-7,52 (м, 2H), 7,58-7,67 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).

Таблица 33

Сполука №	¹ H-ЯМР
135	0,87 (т, 3H), 1,43 (д, 3H), 1,54 (м, 2H), 3,28 (м, 2H), 4,81 (м, 1H), 6,95 (м, 1H), 7,26-7,30 (м, 2H), 7,39 (д, 1H), 7,51 (м, 1H), 7,59-7,66 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,82(д, 1H).
136	1,00 (с, 9H), 1,99 (ш, 1H), 4,39 (д, 1H), 6,91 (д, 1H), 7,23 (м, 1H), 7,48 (д, 1H), 7,53 (д, 1H), 7,60-7,68 (м, 4H), 8,10 (д, 1H), 8,80(д, 1H).
137	2,11 (м, 1H), 2,49 (м, 1H), 2,85 (ш, 1H), 2,91 (м, 1H), 3,20 (м, 1H), 5,50 (м, 1H), 6,76 (д, 1H), 7,11 (д, 1H), 7,26 (т, 1H), 7,52 (т, 1H), 7,55-7,71 (м, 3H), 8,13 (д, 1H), 8,82 (с, 1H).
140	1,60 (д, 3H), 3,24 (с, 3H), 4,86 (к, 1H), 6,78 (д, 1H), 7,01 (т, 1H), 7,25-7,35 (м, 2H), 7,42-7,50 (м, 3H), 8,83 (д, 1H).
142	1,61 (д, 3H), 3,1 8 (с, 3H), 5,08 (к, 1H), 6,94 (дд, 1H), 7,15 (т, 1H), 7,27-7,37 (м, 2H), 7,41-7,49 (м, 2H), 8,81 (д, 1H).
143	0,44-0,67 (м, 4H), 1,62 (м, 1H), 2,86 (д, 1H), 4,57 (т, 1H), 6,84 (дд, 1H), 7,20 (т, 1H), 7,26 (м, 1H), 7,34 (м, 1H), 7,47-7,50 (м, 2H), 7,61 (д, 1H), 8,86 (д, 1H).
145	1,10 (с, 9H), 3,32 (д, 1H), 5,18 (д, 1H), 6,76 (дд, 1H), 7,14 (т, 1H), 7,24 (м, 1H), 7,37 (м, 1H), 7,47-7,53 (м, 2H), 7,71 (д, 1H), 8,83 (д, 1H).
146	1,65 (д, 3H), 2,99 (д, 1H), 5,50 (м, 1H), 6,81 (д, 1H), 7,15-7,27 (м, 2H), 7,36 (м, 1H), 7,48-7,50 (м, 2H), 7,60 (м, 1H), 8,86 (д, 1H).
147	1,62 (д, 3H), 3,20 (с, 3H), 5,07 (к, 1H), 6,91 (дд, 1H), 7,22-7,35 (м, 3H), 7,41-7,49 (м, 3H), 8,81 (д, 1H).
148	1,65 (д, 3H), 3,00 (д, 1H), 5,47 (м, 1H), 6,84 (д, 1H), 7,10 (т, 1H), 7,30-7,51 (м, 4H), 7,61 (д, 1H), 8,86 (д, 1H).
149	1,61 (д, 3H), 3,19 (с, 3H), 5,06 (к, 1H), 6,96 (д, 1H), 7,17 (т, 1H), 7,28 (м, 1H), 7,43-7,51 (м, 4H), 8,81 (д, 1H).

150	1,50 (д, 3H), 2,54 (с, 3H), 3,16 (с, 3H), 4,92 (к, 1H), 6,84 (д, 1H), 7,08 (д, 1H), 7,21 (т, 1H), 7,26-7,34 (м, 2H), 7,38-7,46 (м, 2H), 8,84 (д, 1H).
152	1,61 (д, 3H), 2,83 (с, 3H), 3,16 (с, 3H), 5,05 (к, 1H), 6,85 (дд, 1H), 7,21-7,32 (м, 4H), 7,34-7,40 (м, 2H).
153	1,63 (д, 3H), 3,29 (с, 3H), 4,97 (к, 1H), 7,18 (д, 1H), 7,32-7,51 (м, 5H), 7,61 (д, 1H), 8,83 (д, 1H).
154	1,62 (д, 3H), 3,22 (с, 3H), 4,08 (с, 3H), 5,08 (к, 1H), 6,91 (д, 1H), 6,97 (м, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,25 (м, 1H), 7,41-7,47 (м, 3H), 8,76 (д, 1H).
155	1,58 (д, 3H), 3,20 (с, 3H), 3,90 (с, 3H), 4,00 (с, 3H), 5,00 (к, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,78 (д, 1H), 6,95 (д, 1H), 7,21-7,28 (м, 2H), 7,39-7,4 (м, 2H), 8,78 (ш, 1H).
156	1,63 (д, 3H), 3,82 (д, 2H), 4,98 (дд, 1H), 5,15 (дд, 1H), 5,21 (к, 1H), 5,70 (м, 1H), 6,92 (дд, 1H), 7,24-7,33 (м, 3H), 7,39-7,49 (м, 3H), 8,82 (д, 1H).
157	1,02 (т, 3H), 1,92-2,08 (м, 2H), 2,84 (д, 1H), 5,23 (м, 1H), 6,80 (дд, 1H), 7,18 (т, 1H), 7,24 (м, 1H), 7,35 (м, 1H), 7,45-7,51 (м, 2H), 7,60 (м, 1H), 8,84 (д, 1H).

Таблица 34

Сполука №	¹ H-ЯМР
160	1,65 (д, 3H), 4,33 (д, 1H), 4,38 (д, 1H), 5,25 (д, 1H), 6,93 (дд, 1H), 7,13 (м, 5H), 7,25-7,42 (м, 6H), 8,79 (д, 1H).
161	6,56 (д, 1H), 6,78 (м, 1H), 7,2-7,5 (м, 11H), 8,50 (д, 1H).
163	0,85 (т, 3K), 1,2-1,4 (м, 4H), 1,9-2,1 (м, 2H), 2,90 (д, 1H), 5,31 (м, 1H), 6,80 (дд, 1H), 7,1-7,6 (м, 6H), 8,83 (д, 1H).
164	2,25 (м, 1H), 3,53 (д, 1H), 6,07 (дд, 1H), 6,86 (м, 1H), 7,2-7,7 (м, 6H), 8,85 (д, 1H).
165	0,13 (с, 9H), 6,45 (с, 1H), 6,94 (д, 1H), 7,29-7,38 (м, 3H), 7,48-7,50 (м, 2H), 7,59 (м, 1H), 8,86 (д, 1H).
167	1,62 (д, 3H), 3,20 (с, 3H), 5,08 (к, 1H), 6,91 (дд, 1H), 7,21-7,34 (м, 3H), 7,42-7,47 (м, 3H), 8,81 (д, 1H).
168	3,51 (с, 3H), 3,65 (с, 3H), 5,44 (с, 1H), 6,89 (м, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,78 (д, 1H).
170	0,02 (с, 9H), 2,26 (с, 3H), 5,52 (с, 1H), 6,86 (дд, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,75 (д, 1H).
171	2,22 (с, 3H), 4,13 (д, 1H), 5,66 (д, 1H), 6,91 (м, 1H), 7,3-7,6 (м, 6H), 8,76 (д, 1H).
172	2,34 (с, 3H), 3,46 (с, 3H), 5,28 (с, 1H), 6,9 (м, 1H), 7,2-7,26 (м, 6H), 8,81 (д, 1H).
173	1,26 (с, 3H), 1,45 (с, 3H), 3,67 (д, 1H), 5,27 (д, 1H), 6,83 (д, 1H), 7,1-7,5 (м, 6H), 7,66 (шс, 1H), 8,82 (д, 1H).
174	2,97 (д, 1H), 3,31 (м, 2H), 5,59 (м, 1H), 6,75 (д, 1H), 7,13-7,49 (м, 11H), 8,77 (ш, 1H).
175	3,19 (с, 3H), 3,28-3,44 (м, 2H), 5,18 (т, 1H), 6,82 (д, 1H), 7,11-7,49 (м, 11H), 8,67 (ш, 1H).
177	1,60 (д, 3H), 3,17 (с, 3H), 5,04 (к, 1H), 6,97 (дд, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,26-7,36 (м, 2H), 7,42-7,49 (м, 2H), 8,81 (д, 1H).
180	1,23 (с, 3H), 1,40 (с, 3H), 3,20 (с, 3H), 4,87 (с, 1H), 6,94 (д, 1H), 7,26-7,35 (м, 3H), 7,45-7,48 (м, 3H), 8,75 (д, 1H).
181	3,59 (д, 1H), 3,70 (с, 3H), 5,79 (д, 1H), 6,8-6,95 (м, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,77 (д, 1H).
185	1,71 (т, 3H), 3,06 (м, 1H), 5,34 (м, 1H), 7,08 (д, 1H), 7,32-7,41 (м, 2H), 7,49-7,52 (м, 3H), 7,67 (дд, 1H), 8,86 (д, 1H).
186	1,67 (д, 3H), 3,16 (с, 3H), 4,85 (к, 1H), 7,21 (д, 1H), 7,32 (м, 1H), 7,41-7,47 (м, 4H), 7,58 (д, 1H), 8,80 (д, 1H).
188	1,63 (д, 3H), 3,23 (с, 3H), 5,10 (к, 1H), 6,89 (дд, 1H), 7,18-7,29 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,52 (т, 1H), 7,60-7,69 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).
189	1,48 (д, 3H), 1,97 (д, 1H), 5,17 (м, 1H), 7,15 (м, 1H), 7,24-7,35 (м, 2H), 7,45-7,52 (м, 2H), 7,58-7,63 (м, 2H), 8,09 (д, 1H), 8,87 (д, 1H).
190	1,61 (д, 3H), 2,69 (м, 1H), 5,43 (м, 1H), 7,09 (т, 1H), 7,27-7,34 (м, 2H), 7,52 (т, 1H), 7,60-7,67 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,87 (д, 1H).
198	1,61 (д, 3H), 2,83 (с, 3H), 3,16 (с, 3H), 5,04 (к, 1H), 6,84 (дд, 1H), 7,19-7,36 (м, 5H).

Таблиця 35

Сполука №	¹ H-ЯМР
200	1,62 (д, 3H), 3,22 (с, 3H), 5,09 (к, 1H), 6,87 (дд, 1H), 7,1-7,4 (м, 3H), 7,46 (д, 1H), 7,6-7,8 (м, 2H), 8,78 (д, 1H).
204	1,78 (с, 3H), 3,74 (с, 3H), 4,14 (д, 1H), 5,85 (д, 1H), 6,93 (м, 1H), 7,2-7,5 (м, 6H), 8,78 (д, 1H).
206	1,77 (д, 1H), 2,71 (с, 3H), 5,52 (м, 1H), 6,24 (дд, 1H), 6,83 (м, 1H), 7,07 (м, 1H), 7,42-7,77 (м, 2H), 7,80 (м, 1H).
207	1,52 (дд, 3H), 2,29 (с, 6H), 3,95 (к, 1H), 6,78 (д, 1H), 6,97 (м, 1H), 7,23-7,34 (м, 2H), 7,43-7,47 (м, 3H), 8,84 (д, 1H).
209	1,60 (д, 3H), 3,19 (с, 3H), 3,92 (с, 3H), 4,82 (к, 1H), 7,0-7,1 (м, 1H), 7,2-7,5 (м, 6H), 8,84 (д, 1H).
210	1,59 (д, 3H), 2,59 (с, 3H), 3,23 (с, 3H), 4,76 (к, 1H), 6,99 (дд, 1H), 7,11 (дд, 1H), 7,2-7,5 (м, 5H), 8,85 (д, 1H).
211	1,60 (д, 3H), 2,51 (с, 3H), 3,23 (с, 3H), 5,04 (к, 1H), 6,78 (дд, 1H), 7,12 (д, 1H), 7,2-7,5 (м, 5H), 8,83 (д, 1H).
212	1,74 (д, 3H), 3,24 (с, 3H), 3,26 (с, 3H), 5,48 (к, 1H), 7,2-7,5 (м, 5H), 8,03 (д, 1H), 8,81 (д, 1H).
215	1,60 (д, 3H), 3,02 (с, 3H), 4,48 (к, 1H), 7,02 (дд, 1H), 7,12 (дд, 1H), 7,2-7,55 (м, 10H), 8,85 (д, 1H).
217	3,42 (с, 6H), 5,65 (с, 1H), 6,79 (д, 1H), 7,01 (т, 1H), 7,29-7,37 (м, 2H), 7,45-7,48 (м, 3H), 8,86 (д, 1H).
218	1,11 (т, 6H), 3,49 (м, 2H), 3,74 (м, 2H), 5,78 (с, 1H), 6,80 (д, 1H), 7,01 (т, 1H), 7,27-7,36 (м, 2H), 7,43-7,49 (м, 3H), 8,86 (д, 1H).
220	3,35 (с, 3H), 4,66 (с, 2H), 6,92 (дд, 1H), 7,29-7,35 (м, 3H), 7,44-7,46 (м, 3H), 8,88 (д, 1H).
221	3,99 (м, 2H), 4,70 (с, 2H), 5,08 (д, 1H), 5,17 (д, 1H), 5,78 (м, 1H), 6,93 (дд, 1H), 7,28-7,35 (м, 3H), 7,44-7,49 (м, 3H), 8,88 (д, 1H).
223	3,36 (с, 3H), 4,66 (с, 2H), 6,96 (д, 1H), 7,22 (т, 1H), 7,33 (м, 1H), 7,45-7,52 (м, 3H), 8,88 (д, 1H).
224	0,83 (т, 3H), 1,30 (м, 2H), 1,40 (м, 2H), 2,60 (т, 2H), 3,99 (с, 2H), 6,90 (д, 1H), 7,20-7,37 (м, 3H), 7,44-7,50 (м, 3H), 8,87 (д, 1H).
225	0,99 (с, 6H), 1,48 (с, 6H), 1,63 (д, 1H), 3,57 (д, 1H), 6,93 (д, 1H), 7,1 4-7,26 (м, 2H), 7,44-7,71 (м, 5H), 8,00 (д, 1H), 8,77 (ш, 1H).
226	0,95 (с, 6H), 1,42 (с, 6H), 2,43 (с, 3H), 4,01 (с, 2H), 6 87 (д, 1H), 7,11 (м, 1H), 7,20 (м, 1H), 7,28 (д, 2H), 7,40-7,54 (м, 3H), 7,59-7,74 (м, 4H), 8,10 (д, 1H), 8,68 (д, 1H).
227	1,23 (с, 6H), 1,52 (с, 6H), 2,49 (с, 1H), 6,94 (д, 1H), 7,18-7,26 (м, 2H), 7,49-7,68 (м, 5H), 8,10 (д, 1H), 8,77 (д, 1H).
230	0,87 (с, 3H), 1,04 (с, 3H), 1,22 (д, 3H), 1,52 (д, 6H), 1,68 (д, 1H), 4,08 (м, 1H), 6,94 (м, 1H), 7,15- 7,26 (м, 2H), 7,46-7,54 (м, 2H), 7,59-7,68 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).
232	1,38 (с, 6H), 1,65 (с, 6H), 6,95 (м, 1H), 7,19-7,31 (м, 2H), 7,47 (д, 1H), 7,52 (м, 1H), 7,60-7,69 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,75 (д, 1H).

Таблиця 36

Сполука №	¹ H-ЯМР
234	1,49 (с, 6H), 6,92 (м, 1H), 7,19-7,33 (м, 2H), 7,48-7,71 (м, 5H), 8,02 (д, 1H), 8,72 (д, 1H), 9,72 (с, 1H).
235	1,05 (с, 6H), 1 57(с, 6H), 3,64 (д, 1H), 6,73 (д, 1H), 6,87 (м, 1H), 7,15 (м, 1H), 7,81-7,55 (м, 2H), 7,61-7,73 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,75 (д, 1H).
243	1,08 (с, 6H), 1,52 (с, 6H), 2,26 (с, 2H), 6,88 (м, 1H), 7,17 (м, 1H), 7,36 (с, 2H), 7,50-7,70 (м, 4H), 8,81 (д, 1H), 8,91 (д, 1H).
244	1,02 (ш, 1H), 1,46 (с, 6H), 2,19 (т, 2H), 3,56 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 7,13-7,24 (м, 2H), 7,43 (д, 1H), 7,49-7,54 (м, 2H), 7,60-7,70 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,81 (д, 1H).
246	1,06 (д, 3H), 1,50 (д, 6H), 1,96 (дд, 1H), 2,15 (дд, 1H), 3,83 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 7,13-7,26 (м, 2H), 7,46-7,55 (м, 2H), 7,59-7,70 (м, 3H), 8,11 (д, 1H), 8,82 (д, 1H).

247	1,47 (с, 6H), 2,21 (д, 2H), 3,16 (с, 6H), 4,19 (т, 1H), 6,87 (дд, 1H), 7,13-7,20 (м, 2H), 7,44 (м, 1H), 7,49 (т, 1H), 7,54-7,70 (м, 3H), 8,10 (д, 1H), 8,31 (д, 1H).
248	0,99 (с, 6H), 1,49 (с, 6H), 3,43 (с, 6H), 3,95 (с, 1H), 6,93 (д, 1H), 7,12-7,24 (м, 2H), 7,42 (д, 1H), 7,48-7,67 (м, 4H), 8,09 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).
251	1,26 (с, 6H), 1,56 (с, 6H), 2,48 (с, 1H), 2,79 (с, 1H), 6,88 (м, 1H), 7,19-7,30 (м, 3H), 7,43 (т, 1H), 7,56-7,61 (м, 3H), 8,02 (д, 1H).
252	0,97 (т, 1H), 1,47 (с, 6H), 2,19 (т, 2H), 2,84 (с, 3H), 3,57 (м, 1H), 6,83 (дд, 1H), 7,11-7,23 (м, 2H), 7,37 (с, 1H), 7,41-7,46 (м, 2H), 7,56-7,62 (м, 2H), 8,02 (д, 1H).
253	1,09 (д, 3H), 1,40 (с, 3H), 1,45 (с, 3H), 1,72 (шс, 1H), 4,54 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 7,1-7,3 (м, 2H), 7,4-7,7 (м, 5H), 8,09 (д, 1H), 8,77 (д, 1H).
254	0,91 (т, 3H), 1,2-1,5 (м, 8H), 1,6-1,7 (м, 1H), 4,1-4,2 (м, 1H), 6,90 (дд, 1H), 7,1-7,3 (м, 2H), 7,4-7,7 (м, 5H), 8,10 (д, 1H), 8,77 (д, 1H).
255	1,43 (с, 3H), 1,49 (с, 3H), 1,57 (с, 3H), 1,75 (д, 1H), 4,8-5,0 (м, 3H), 6,91 (дд, 1H), 7,1-7,3 (м, 2H), 7,4-7,7 (м, 5H), 8,10 (д, 1H), 8,81 (д, 1H).
256	0,89 (с, 3H), 1,06-1,10 (м, 6H), 1,23 (ш, 6H), 2,81 (с, 3H), 4,09 (м, 1H), 6,88 (д, 1H), 7,18-7,26 (м, 3H), 7,42 (т, 1H), 7,55-7,64 (м, 3H), 8,01 (д, 1H).
257	1,24 (с, 6H), 1,53 (ш, 6H), 1,88 (с, 3H), 2,83 (с, 3H), 6,87 (д, 1H), 7,13-7,26 (м, 3H), 7,41-7,46 (м, 2H), 7,56-7,60 (м, 2H), 8,03 (д, 1H).
258	1,11 (ш, 1H), 1,45 (с, 6H), 2,37 (т, 2H), 3,55 (м, 2H), 6,90 (м, 1H), 7,15-7,34 (м, 3H), 7,42-7,46 (м, 3H), 7,53 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).
259	0,98 (ш, 1H), 1,46 (с, 6H), 2,17 (т, 2H), 2,86 (с, 3H), 3,57 (м, 2H), 6,86 (д, 1H), 7,15-7,30 (м, 3H), 7,36-7,37 (м, 3H), 7,45 (м, 1H).
260	1,51 (с, 6H), 2,11 (с, 3H), 6,91 (дд, 1H), 7,2-7,3 (м, 2H), 7,5-7,7 (м, 5H), 8,11 (д, 1H), 8,71 (д, 1H).
261	1,47 (с, 6H), 2,28 (т, 2H), 2,84 (с, 3H), 3,66 (с, 3H), 4,04 (т, 2H), 6,84 (м, 1H), 7,12-7,28 (м, 3H), 7,30-7,45 (м, 4H).

Таблица 37

Сполука №	¹ H-ЯМР
262	1,59 (с, 6H), 2,18 (с, 3H), 6,72 (м, 1H), 6,96 (м, 1H), 7,2-7,6 (м, 5H), 8,73 (д, 1H).
263	1,3 (с, 6H), 1,63 (с, 6H), 6,74 (д, 1H), 6,91 (м, 1H), 7,18 (м, 1H), 7,5-7,8 (м, 4H), 8,10 (д, 1H), 8,75 (д, 1H).
265	1,60 (с, 6H), 2,18 (с, 3H), 6,70 (д, 1H), 6,92 (м, 1H), 7,20 (м, 1H), 7,5-7,8 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,69 (д, 1H).
266	1,59 (д, 6H), 2,18 (с, 3H), 6,68 (д, 2H), 6,92 (дд, 1H), 6,96-7,24 (м, 1H), 7,31-7,37 (м, 1H), 7,55 (д, 1H), 7,67-7,75 (м, 2H), 8,69 (д, 1H).
267	1,59 (д, 6H), 2,18 (с, 3H), 6,70 (д, 1H), 6,96 (дд, 1H), 7,19-7,25 (м, 1H), 7,40-7,49 (м, 2H), 7,53 (д, 1H), 8,75 (д, 1H).
268	0,87 (д, 3H), 1,39 (с, 3H), 1,44 (с, 3H), 1,85 (с, 1H), 4,50 (м, 1H), 6,91 (д, 1H), 7,16-7,33 (м, 3H), 7,43-7,52 (м, 3H), 8,81 (д, 1H).
269	1,51 (с, 6H), 2,14 (с, 3H), 6,92 (д, 1H), 7,22-7,36 (м, 3H), 7,44-7,48 (м, 2H), 7,50-7,58 (м, 2H), 8,73 (д, 1H).
270	1,88 (с, 6H), 2,86 (с, 3H), 6,88 (д, 1H), 7,18-7,43 (м, 5H), 7,50-7,56 (м, 2H).
271	1,89 (с, 6H), 6,93 (д, 1H), 7,20 (м, 1H), 7,31 (м, 1H), 7,54 (т, 1H), 7,63-7,73 (м, 2H), 8,12 (д, 1H), 8,83 (д, 1H).
277	0,82 (т, 3H), 1,20 (т, 3H), 1,64 (м, 1H), 3,04 (м, 1H), 6,98 (м, 1H), 7,19-7,26 (м, 2H), 7,32-7,39 (м, 2H), 7,49 (т, 1H), 7,52-7,65 (м, 2H), 8,10 (д, 1H), 8,83 (ш, 1H).
278	0,79 (д, 3H), 0,94 (д, 3H), 1,21 (д, 3H), 1,78-1,90 (м, 1H), 2,80-2,90 (м, 1H), 6,94-6,99 (м, 1H), 7,18-7,4 (м, 2H), 7,35 (д, 1H), 7,49 (т, 1H), 7,58-7,65 (м, 3H), 8,00 (д, 1H), 8,93 (ш, 1H).
280	2,24 (с, 3H), 2,72 (с, 3H), 4,13 (д, 1H), 5,51 (д, 1H), 6,69 (д, 1H), 7,02 (т, 1H), 7,2-7,6 (м, 5H).
286	1,73-1,82 (м, 4H), 2,66-2,70 (м, 2H), 2,82-2,84 (м, 2H), 6,82 (д, 1H), 6,98 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,31 (д, 1H), 7,48-7,76 (м, 4H), 8,07-8,14 (м, 2H), 8,83 (д, 1H).
289	1,26 (т, 3H), 4,25 (к, 2H), 6,73 (д, 1H), 7,01 (т, 1H), 7,41 (м, 1H), 7,56 (т, 1H), 7,63 (д, 1H), 7,66-7,75 (м, 2H), 8,12 (д, 1H), 8,74 (д, 1H).

295	3,13 (с, 3H), 3,63 (с, 3H), 6,76 (д, 1H), 7,03 (м, 1H), 7,31-7,52 (м, 4H), 7,60 (дд, 1H), 8,78 (д, 1H).
297	1,01 (м, 2H), 1,31 (м, 2H), 4,53 (с, 2H), 6,79 (д, 1H), 6,98 (т, 1H), 7,08-7,11 (м, 2H), 7,16-7,18 (м, 3H), 7,28-7,49 (м, 5H), 8,87 (д, 1H).
308	1,66 (с, 3H), 2,93 (д, 1H), 2,99 (д, 1H), 6,74 (д, 1H), 6,95 (т, 1H), 7,26-7,36 (м, 2H), 7,46-7,48 (м, 2H), 7,54 (д, 1H), 8,85 (д, 1H).
328	3,45 (с, 6H), 4,54 (с, 2H), 5,93 (с, 1H), 7,04 (д, 1H), 7,17 (т, 1H), 7,27 (м, 1H), 7,31 (м, 1H), 7,43 (м, 1H), 7,50 (м, 1H), 7,85 (с, 1H), 8,86 (д, 1H).
329	1,27 (т, 3H), 4,26 (к, 2H), 4,60 (с, 2H), 7,27-7,52 (м, 6H), 7,81 (с, 1H), 7,99 (д, 1H), 8,88 (д, 1H).
330	1,18 (т, 3H), 4,24 (к, 2H), 4,30 (с, 2H), 7,01-7,07 (м, 2H), 7,35 (м, 1H), 7,51 (т, 1H), 7,67 (т, 1H), 7,72 (д, 1H), 7,85 (с, 1H), 8,07 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).

Таблица 38

Сполука №	¹ H-ЯМР
331	1,15 (т, 3H), 4,09 (к, 2H), 4,28 (с, 2H), 7,02-7,07 (м, 2H), 7,27-7,40 (м, 2H), 7,68-7,83 (м, 2H), 8,16 (д, 1H), 8,78 (д, 1H).
334	5,28-5,61 (м, 2H), 5,83-6,12 (м, 2H), 7,18-7,42 (м, 4H), 7,54-8,10 (м, 4H), 8,47 (дд, 1H), 9,02 (д, 1H).
339	1,55 (д, 3H), 1,68 (д, 3H), 6,14 (с, 1H), 7,32-7,41 (м, 2H), 7,51-7,63 (м, 3H), 7,81-7,88 (м, 2H), 8,16 (д, 1H), 8,44 (д, 1H), 9,24 (д, 1H).
340	7,52-7,67 (м, 5H), 7,83-7,88 (м, 2H), 7,96 (м, 1H), 8,08 (д, 1H), 8,18-8,21 (м, 2H), 8,53 (д, 1H), 9,42 (д, 1H).
343	5,94 (дд, 1H), 6,22 (дд, 1H), 6,89 (дд, 1H), 7,54-7,87 (м, 7H), 8,14 (м, 1H), 8,47 (д, 1H), 9,28 (д, 1H).
344	1,66 (с, 3H), 3,02 (с, 2H), 4,50 (м, 1H), 4,70 (м, 1H), 7,31 -7,71 (м, 7H), 8,50 (м, 1H), 9,33 (д, 1H).
345	3,07 (т, 2H), 3,58 (т, 2H), 7,35-7,71 (м, 5H), 7,84-7,91 (м, 2H), 8,19 (д, 1H), 8,50 (д, 1H), 9,36 (д, 1H).
347	1,64 (с, 3H), 3,53 (с, 2H), 4,40 (м, 1H), 4,64 (м, 1H), 7,17 (дд, 1H), 7,26-7,42 (м, 2H), 7,63 (м, 1H), 7,82-7,90 (м, 2H), 8,18 (м, 1H), 8,46 (д, 1H), 9,30 (д, 1H).
350	1,67 (д, 3H), 1,75 (д, 3H), 2,80 (шс, 1H), 5,04 (шс, 1H), 6,54 (с, 1H), 7,02-7,10 (м, 2H), 7,18-7,55 (м, 5H), 8,04 (с, 1H), 8,85 (д, 1H).
351	3,94-4,00 (м, 2H), 5,12-5,26 (м, 3H), 5,75 (д, 1H), 6,09 (м, 1H), 6,49 (дд, 1H), 7,10 (м, 1H), 7,38-7,53 (м, 3H), 7,69-7,76 (м, 3H), 8,00 (д, 1H), 8,12 (д, 1H), 9,48 (д, 1H).
352	1,17 (т, 3H), 4,20 (к, 2H), 6,94 (д, 1H), 7,31 (т, 1H), 7,55-7,61 (м, 2H), 7,67-7,77 (м, 3H), 8,04 (д, 1H), 8,14 (д, 1H), 8,80 (ш, 1H).
353	2,61 (с, 3H), 6,90 (д, 1H), 7,28-7,38 (м, 3H), 7,45-7,51 (м, 2H), 7,58 (м, 1H), 8,86 (д, 1H).
355	2,61 (с, 3H), 6,93 (д, 1H), 7,23-7,37 (м, 2H), 7,43-7,49 (м, 3H), 7,57 (с, 1H), 8,82 (ш, 1H).
359	2,61 (с, 3H), 2,74 (с, 3H), 6,78 (дд, 1H), 7,24-7,46 (м, 5H), 7,46 (с, 1H).
360	1,24 (д, 6H), 3,16 (сеп, 1H), 6,88 (д, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,81 (д, 1H).
361	2,60 (с, 3H), 6,93 (дд, 1H), 7,21 (т, 1H), 7,35 (м, 1H), 7,47-7,51 (м, 3H), 8,83 (д, 1H).
363	1,06 (м, 2H), 1,25 (м, 2H), 2,29 (м, 1H), 6,96 (дд, 1H), 7,29-7,38 (м, 3H), 7,43-7,53 (м, 3H), 8,83 (д, 1H).
364	2,00 (с, 3H), 5,79 (с, 1H), 6,06 (с, 1H), 6,90 (д, 1H), 7,26-7,37 (м, 3H), 7,45-7,51 (м, 2H), 7,57 (м, 1H), 8,78 (ш, 1H).
365	1,33 (с, 9H), 6,90 (дд, 1H), 7,26-7,37 (м, 3H), 7,46-7,51 (м, 2H), 7,54 (м, 1H), 8,81 (д, 1H).
367	2,62 (с, 3H), 2,65 (с, 3H), 2,80 (с, 3H), 6,59 (д, 1H), 6,92 (т, 1H), 7,26-7,39 (м, 2H), 7,48-7,51 (м, 3H).
368	6,95 (д, 1H), 7,2-7,7 (м, 10H), 7,87 (м, 1H), 8,64 (д, 1H).
371	0,91 (с, 3H), 1,38 (м, 2H), 1,70 (м, 2H), 2,89 (т, 2H), 6,88 (д, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,82 (д, 1H).
373	6,66 (с, 1H), 6,76 (д, 1H), 7,04 (т, 1H), 7,36-7,56 (м, 4H), 7,73 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).

Таблиця 39

Сполука №	¹ H-ЯМР
374	6,79 (д, 1H), 7,04 (т, 1H), 7,35-7,56 (м, 4H), 7,74 (с, 1H), 8,82 (д, 1H).
375	2,46 (с, 3H), 6,86 (д, 1H), 7,2-7,7 (м, 6H), 8,60 (д, 1H).
376	1,57 (с, 6H), 2,7 (шс, 1H), 6,89 (дд, 1H), 7,2-7,7 (м, 6H), 8,82 (д, 1H).
377	1,24 (д, 6H), 3,16 (сеп, 1H), 6,88 (д, 1H), 7,2-7,6 (м, 6H), 8,81 (д, 1H).
382	2,59 (с, 3H), 2,69 (с, 3H), 6,69 (д, 1H), 6,99 (т, 1H), 7,25 (м, 1H), 7,33-7,41 (м, 3H), 8,00 (м, 1H).
383	2,61 (с, 3H), 2,69 (с, 3H), 6,62 (д, 1H), 6,97 (т, 1H), 7,24-7,37 (м, 2H), 7,48 (с, 1H), 7,61-7,69 (м, 2H).
384	2,15 (с, 3H), 5,11 (с, 2H), 6,78 (д, 1H), 7,03 (т, 1H), 7,33-7,53 (м, 4H), 7,64 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).
388	2,61 (с, 3H), 6,80 (д, 1H), 7,02 (м, 1H), 7,22 (м, 1H), 7,39 (м, 1H), 7,58 (м, 1H), 7,79 (д, 1H), 7,92 (д, 1H), 8,81 (д, 1H).
389	2,60 (с, 3H), 2,69 (с, 3H), 6,67 (д, 1H), 6,98 (т, 1H), 7,32-7,45 (м, 3H), 7,58 (д, 1H), 8,03 (с, 1H).
390	6,76 (д, 1H), 7,04 (т, 1H), 7,40 (м, 1H), 7,47-7,57 (м, 3H), 7,75 (с, 1H), 8,82 (д, 1H).
397	1,53 (шс, 6H), 2,73 (с, 3H), 6,67 (д, 1H), 6,99 (т, 1H), 7,2-7,7 (м, 5H).
398	1,53 (д, 6H), 6,98 (т, 1H), 7,3-7,7 (м, 5H), 8,81 (д, 1H).
401	6,97 (д, 1H), 7,10 (т, 1H), 7,26-7,38 (м, 3H), 7,46-7,75 (м, 7H), 8,14 (д, 1H), 8,35 (д, 1H), 8,91 (д, 1H), 9,36 (с, 1H).
402	3,94 (с, 3H), 6,87 (д, 1H), 7,24-7,35 (м, 2H), 7,56 (т, 1H), 7,61-7,73 (м, 3H), 8,11 (д, 1H), 8,79 (д, 1H).
403	3,89 (с, 3H), 6,92 (д, 1H), 7,26 (т, 1H), 7,43 (д, 1H), 7,54 (т, 1H), 7,61-7,74 (м, 3H), 8,11 (д, 1H), 8,79 (д, 1H).
400	1,19 (т, 3H), 2,33 (д, 3H), 4,27 (к, 2H), 6,78 (д, 1H), 7,29-7,35 (м, 2H), 7,44-7,48 (м, 3H), 8,84 (д, 1H).
410	1,41 (с, 9H), 6,97 (д, 1H), 7,28-7,38 (м, 3H), 7,45-7,49 (м, 3H), 8,85 (д, 1H).
427	1,33 (д, 3H), 2,80 (с, 3H), 3,38 (с, 3H), 4,00 (м, 1H), 6,77 (д, 1H), 7,03 (м, 1H), 7,25-7,45 (м, 5H).
428	1,02 (т, 3H), 1,36 (с, 3H), 1,79 (к, 2H), 2,18 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 6,75 (д, 1H), 7,03 (м, 1H), 7,28-7,45 (м, 5H).
430	1,03 (т, 3H), 1,28 (м, 2H), 1,68 (м, 2H), 3,90 (к, 2H), 6,79 (д, 1H), 6,97 (т, 1H), 7,26-7,35 (м, 2H), 7,40-7,50 (м, 3H), 8,83 (д, 1H).
431	0,66-0,87 (м, 2H), 1,12-1,19 (м, 2H), 1,26-1,29 (м, 8H), 1,99 (с, 1H), 6,67 (д, 1H), 6,89 (м, 1H), 7,18 (м, 1H), 7,34 (м, 1H), 7,47-7,50 (м, 2H), 7,62 (м, 1H), 8,82 (д, 1H).
435	1,82 (д, 6H), 5,28 (ш, 2H), 6,62 (д, 1H), 6,87 (дд, 1H), 7,19 (м, 1H), 7,33 (м, 1H), 7,43-7,51 (м, 2H), 7,68 (м, 1H), 8,79 (д, 1H).
437	1,93 (д, 6H), 6,72 (м, 1H), 6,91-6,98 (м, 2H), 7,19-7,38 (м, 2H), 7,43-7,52 (м, 2H), 7,58 (м, 1H), 8,83 (д, 1H).
442	2,46 (с, 6H), 5,22 (с, 1H), 6,8-7,0 (м, 1H), 7,2-7,5 (м, 5H), 7,67 (дд, 1H), 8,84 (д, 1H).

Таблиця 40

Сполука №	¹ H-ЯМР
443	2,07 (с, 3H), 6,78 (д, 1H), 6,80 (шс, 1H), 7,03 (д, 1H), 7,2-7,6 (м, 5H), 7,78 (м, 1H), 8,88 (д, 1H).
445	1,54 (дд, 3H), 1,61-1,69 (м, 4H), 2,34-2,39 (м, 2H), 2,54-2,59 (м, 2H), 3,92 (к, 1H), 6,79 (м, 1H), 6,97 (м, 1H), 7,22-7,33 (м, 2H), 7,39 (м, 1H), 7,43-7,47 (м, 2H), 8,83 (д, 1H).
446	1,47 (д, 3H), 1,54 (с, 9H), 3,29 (с, 3H), 4,97 (к, 1H), 6,67 (д, 1H), 7,2-7,5 (м, 5H), 8,04 (д, 1H), 8,66 (шс, 1H), 8,85 (д, 1H).
447	1,50 (д, 3H), 3,26 (с, 3H), 4,88 (шс, 2H), 4,93 (к, 2H), 6,33 (дд, 1H), 6,52 (дд, 1H), 7,07 (т, 1H), 7,2-7,5 (м, 4H), 8,84 (д, 1H).
448	1,47 (д, 3H), 2,89 (д, 3H), 3,23 (с, 3H), 4,94 (к, 2H), 5,78 (шс, 1H), 6,30 (дд, 1H), 6,51 (д, 1H), 7,19 (т, 1H), 7,24-7,43 (м, 5H), 8,84 (д, 1H).

449	2,11 (ш, 6H), 2,84 (с, 3H), 2,92 (с, 3H), 6,68 (м, 1H), 6,96 (м, 1H), 7,27-7,44 (м, 4H), 7,49 (д, 1H).
450	2,11 (д, 6H), 2,91 (с, 3H), 6,74 (м, 1H), 6,97 (м, 1H), 7,29-7,51 (м, 3H), 7,67 (м, 1H), 8,82 (д, 1H).
451	2,16 (ш, 6H), 2,81 (с, 3H), 2,92 (с, 3H), 6,65 (д, 1H), 6,98 (м, 1H), 7,26-7,42 (м, 3H), 7,50 (с, 1H).
452	1,38 (т, 3H), 2,11 (с, 6H), 3,08 (к, 2H), 6,76 (д, 1H), 6,98 (м, 1H), 7,30-7,38 (м, 2H), 7,47-7,54 (м, 2H), 7,70 (д, 1H), 8,84 (д, 1H).
453	1,99 (д, 3H), 2,95 (с, 3H), 5,20 (к, 1H), 6,84 (м, 1H), 7,23-7,55 (м, 5H), 7,78 (м, 1H), 8,83 (д, 1H).
a-2	1,67 (с, 6H), 6,00 (с, 1H), 7,54-7,61 (м, 2H), 7,66-7,74 (м, 2H), 8,14 (д, 1H), 8,38 (т, 1H), 8,80 (д, 1H).
a-7	1,66 (с, 6H), 2,81 (с, 3H), 6,02 (с, 1H), 7,19-7,43 (м, 6H), 8,40 (д, 1H).
a-8	1,65 (с, 6H), 5,96 (с, 1H), 7,25-7,39 (м, 3H), 7,48-7,58 (м, 3H), 8,41 (м, 1H), 8,85 (д, 1H).
b-1	1,18 (с, 6H), 1,50 (с, 6H), 1,75-1,93 (м, 4H), 2,73 (т, 2H), 2,84 (с, 1H), 2,89 (т, 2H), 6,82 (дд, 1H), 6,96 (д, 1H), 7,08-7,20 (м, 2H), 7,49 (дд, 1H), 8,10 (д, 1H).
b-3	1,27 (с, 6H), 1,60 (д, 6H), 1,76-1,94 (м, 4H), 2,49 (с, 1H), 2,74 (т, 2H), 2,90 (т, 2H), 6,62 (д, 1H), 6,79-6,86 (м, 1H), 6,97 (д, 1H), 7,08-7,15 (м, 1H), 8,10 (д, 1H).
b-4	1,19 (с, 6H), 1,50 (с, 6H), 2,11-2,21 (м, 2H), 2,83 (с, 1H), 2,90 (т, 2H), 2,95 (т, 2H), 6,81 (дд, 1H), 7,08-7,21 (м, 3H), 7,50 (дд, 1H), 8,08 (д, 1H).
b-5	1,19 (с, 6H), 1,50 (с, 6H), 1,62-1,73 (м, 4H), 1,83-1,90 (м, 2H), 2,70-2,73 (м, 2H), 2,92 (с, 1H), 3,00-3,04 (м, 2H), 6,84 (дд, 1H), 7,01 (д, 2H), 7,07-7,20 (м, 2H), 7,48 (дд, 1H), 8,00 (д, 1H).
b-6	1,76-1,95 (м, 4H), 2,59 (с, 3H), 2,75 (т, 2H), 2,91 (т, 2H), 6,63 (д, 1H), 6,88 (т, 1H), 7,03 (д, 1H), 7,24-7,32 (м, 1H), 8,16 (д, 1H).
b-7	1,74 (д, 6H), 1,74-1,95 (м, 4H), 2,76 (т, 2H), 2,92 (т, 2H), 4,26 (д, 1H), 6,55 (дд, 1H), 6,79-6,86 (м, 1H), 7,05 (д, 1H), 7,07-7,15 (м, 1H), 8,18 (д, 1H).
b-8	1,08 (с, 9H), 1,71 (д, 3H), 1,74-1,95 (м, 4H), 2,75 (т, 2H), 2,91 (т, 2H), 5,00 (с, 1H), 6,53 (д, 1H), 6,77-6,84 (м, 1H), 7,06 (с, 1H), 7,08-7,26 (м, 1H), 8,20 (д, 1H).
b-9	1,63 (д, 3H), 1,76-1,95 (м, 4H), 2,75 (т, 2H), 2,77-2,93 (м, 2H), 3,48 (с, 1H), 5,29-5,34 (м, 1H), 6,55 (д, 1H), 6,81 (дд, 1H), 7,03 (д, 1H), 7,13 (к, 1H), 8,16(д, 1H).

Таблица 41

Спо-лука №	¹ H-ЯМР
b-10	1,59 (д, 3 H), 1,65-1,94 (м, 4H), 2,74 (т, 2H), 2,90 (т, 2H), 3,27 (с, 3H), 4,90 (к, 1H), 6,62 (д, 1H), 6,84 (дд, 1H), 6,89 (д, 1H), 7,14-7,22 (м, 1H), 8,11 (д, 1H).
b-11	2,65 (с, 3H), 6,65 (д, 1H), 6,92 (т, 1H), 7,21 (д, 1H), 7,27-7,35 (м, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,69 (д, 1H), 8,43 (д, 1H).
b-12	1,77 (д, 6H), 4,16 (д, 1H), 6,57 (д, 1H), 6,86 (дд, 1H), 7,06-7,18 (м, 1H), 7,20 (д, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,69 (д, 1H), 8,44 (д, 1H).
b-13	1,17 (с, 6H), 1,53 (с, 6H), 2,92 (с, 3H), 2,92 (т, 2H), 3,41 (с, 1H), 3,48 (т, 2H), 6,78 (д, 1H), 6,91 (д, 1H), 6,92-7,15 (м, 2H), 7,42 (дд, 1H), 7,65 (д, 1H).
b-14	1,67 (д, 3H), 2,75 (дд, 1H), 5,31-5,41 (м, 1H), 6,58 (д, 1H), 6,87 (м, 1H), 7,1 2-7,21 (м, 2H), 7,61 (д, 1H), 7,67 (д, 1H), 8,44 (д, 1H).
b-15	1,59 (д, 3H), 3,29 (с, 3H), 4,93 (к, 1H), 6,65 (д, 1H), 6,90 (т, 1H), 7,07-7,25 (м, 2H), 7,58 (д, 1H), 7,64 (с, 1H), 8,41 (д, 1H).
b-16	1,06 (с, 9H), 1,75 (д, 3H), 4,93 (с, 1H), 6,54 (д, 1H), 6,84 (дд, 1H), 7,07-7,12 (м, 1H), 7,13 (д, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,75 (д, 1H), 8,45 (д, 1H).
b-19	1,50 (с, 3H), 1,67 (с, 3H), 1,81-1,97 (м, 4H), 2,80 (м, 2H), 2,97 (м, 2H), 5,90 (с, 1H), 7,19-7,37 (м, 3H), 7,72 (м, 1H), 8,55 (д, 1H).
b-20	1,52 (с, 3H), 1,58 (с, 3H), 5,88 (с, 1H), 7,23-7,42 (м, 4H), 7,62 (д, 1H), 8,38 (д, 1H), 8,83 (д, 1H).
b-21	2,59 (с, 3H), 2,80 (т, 2H), 4,07 (т, 2H), 4,73 (с, 2H), 6,65 (д, 1H), 6,91 (т, 1H), 6,97 (д, 1H), 7,28-7,35 (м, 1H), 8,24 (д, 1H).
b-22	1,73 (д, 6H), 2,02 (с, 1H), 3,02 (т, 2H), 4,07 (т, 2H), 4,73 (с, 2H), 6,57 (д, 1H), 6,82-6,89 (м, 1H), 6,98 (д, 1H), 7,10-7,15 (м, 1H), 8,25 (д, 1H).
b-23	2,63 (с, 3H), 6,60 (д, 1H), 6,77 (д, 2H), 6,89 (т, 1H), 7,25-7,32 (м, 1H), 7,62 (д, 1H), 7,76 (д, 1H), 8,1 6 (д, 1H).

(Рецептура)

Приклади фунгіциду згідно з представленим винаходом показані нижче, однак, додаткові агенти і додаткові співвідношення не обмежуються цими прикладами і є можливість значно їх змінювати. Також, частини в прикладах рецептур означають масові частини.

5 Приклад рецептури 1 Змочуваний водою порошок

Сполука згідно з

представленим винаходом 40 частин

Глина 48 частин

Діоктилсульфосукцинат

натрію 4 частини

Лігнінсульфонат натрію 8 частин

Згадані вище компоненти однорідно змішували і тонко подрібнювали одержуючи змочуваний водою порошок з 40 % активного інгредієнта.

Приклад рецептури 2 Емульсія

Сполука згідно з

представленим винаходом 10 частин

SORVESSO 200 53 частини

Циклогексанон 26 частин

Дедецилбензолсульфонат

калію 1 частина

Поліоксиетиленалкїлалїловий

етер 10 частин

10 Згадані вище компоненти змішували і розчиняли одержуючи емульсію з 10 % активного інгредієнта.

Приклад рецептури 3 Порошок

Сполука згідно з

представленим винаходом 10 частин

Глина 90 частин

Згадані вище компоненти однорідно змішували і тонко подрібнювали одержуючи порошок з 10 % активного інгредієнта

15 Приклад рецептури 4 Гранулят

Сполука згідно з

представленим винаходом 5 частин

Глина 73 частини

Бентонїт 20 частин

Діоктилсульфосукцинат

натрію 1 частина

Фосфат калію 1 частина

Згадані вище компоненти добре подрібнювали, змішували і добре змішували з водою, після чого гранулювали і сушили одержуючи гранулят з 5 % активного інгредієнта.

Приклад рецептури 5 Суспензія

Сполука згідно з

представленим винаходом 10 частин

Поліоксиетиленалкїлалїловий

етер 4 частини

Полікарбосилат натрію 2 частини

Гліцерин 10 частин

Ксантанова смола 0,2 частин

Вода 73,8 частин

20 Згадані вище компоненти змішували і піддавали вологому подрібненню до діаметру часточок еквівалентному або менше ніж 3 мікрон одержуючи суспензію з 10 % активного інгредієнта.

Приклад рецептури 6 Гранулят, що диспергується у воді

Сполука згідно з

представленим винаходом 40 частин

Глина 36 частин

Хлорид калію 10 частин

Алкїлбензолсульфонат

натрію 1 частина

Лігнінсульфонат натрію 8 частин
 Продукт конденсації
 формальдегіду з
 алкілбензолсульфонатом
 натрію 5 частин

Згадані вище компоненти змішували і тонко подрібнювали, після чого додавали придатну кількість води і перемішували до утворення глиноподібного матеріалу. Глиноподібний матеріал гранулювали і сушили одержуючи гранулят, що диспергується у воді, з 40 % активного інгредієнта.

5 (Приклад біологічного тесту 1) Контрольний тест на парші яблук

Яблуневі саджанці вирощені в глиняних горщиках (Сорт "Ralls Janet", 3-4 листків), обприскували емульсією сполуки згідно з представленим винаходом з концентрацією активного інгредієнта 100 м.ч.. Після висушування на повітрі при кімнатній температурі, інокулювали конідії бактеріальної парші яблук (*Venturia inaequalis*) і витримували 2 тижні в кімнаті при 20°C при високій вологості, світло і темряву змінювали кожні 12 годин. Визначали контролюючу дію порівнюючи зовнішній стан пошкоджень на листі з необробленими.

Для сполук представлених Сполуками з номерами 3, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 24, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 52, 53, 54, 57, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65 і 66, проводили контрольний тест на парші яблук. Як результат, всі сполуки проявляють принаймні 75 % захисну дію.

Також, такий же самий тест проводили на сполуках представлених Сполуками з номерами 67, 68, 70, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 190, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 215, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 276, 277, 278, 279, 280, 281, 283, 284, 285, 288, 289, 290, 291, 292, 293, 294, 295, 296, 297, 298, 299, 300, 306, 308, 309, 310, 311, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 324, 325, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 344, 347, 348, 349, 350, 353, 354, 355, 356, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 397, 398, 399, 400, 402, 403, 404, 406, 407, 408, 409, 410, 411, 412, 413, 414, 416, 417, 418, 419, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 429, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 437, 439, 440, 441, 442, 443, 445, a-2, a-3, a-4, a-5, a-6, a-7, a-8, a-9, a-10, b-1, b-2, b-3, b-4, b-5, b-6, b-7, b-8, b-9, b-10, b-11, b-12, b-13, b-14, b-15, b-16, b-17, b-20, b-22, b-23, b-24, c-2, c-3, c-4, c-5, d-5, і d-6. Як результат, всі сполуки проявляють принаймні 75 % захисну дію.

(Приклад біологічного тесту 2) Контрольний тест на сірій гнилі огірків

Огіркову розсаду вирощену в глиняних горщиках (Сорт "Cucumis sativus L.", сім'ядоля), обприскували емульсією сполуки згідно з представленим винаходом з концентрацією активного інгредієнта 100 м.ч.. Після висушування на повітрі при кімнатній температурі, інокулювали розприскуванням суспензію конідії бактерій сірої гнилі огірків (*Botrytis cinerea*) і витримували 4 дні в темній кімнаті при 20°C при високій вологості. Визначали контролюючу дію порівнюючи зовнішній стан пошкоджень на листі з необробленими.

Для сполук представлених Сполуками з номерами 10, 11, 12, 15, 18, 19, 22, 26, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 42, 43, 44, 48, 49, 54, 57 і 59, проводили контрольний тест на сірій гнилі огірків. Як результат, всі сполуки проявляють принаймні 75 % захисну дію.

Також, такий же самий тест проводили на сполуках представлених Сполуками з номерами 67, 73, 75, 76, 77, 80, 81, 82, 83, 86, 88, 89, 90, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 133, 134, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 156, 157, 158, 159, 160, 162, 163, 164, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 192, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 205, 208, 209, 210, 219, 220, 221, 222, 223, 225, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 274, 275, 278, 281, 284, 285, 291, 292, 293, 295, 296, 297, 298, 299, 308, 309, 310, 311, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 323, 324, 325, 326,

327, 328, 332, 333, 338, 340, 344, 348, 353, 355, 359, 360, 361, 363, 364, 365, 371, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 386, 391, 392, 393, 395, 397, 398, 399, 402, 403, 405, 406, 412, 414, 416, 417, 418, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 429, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 439, 440, 441, 442, 444, a-2, a-5, a-6, a-7, a-8, a-10, b-1, b-2, b-3, b-7, b-8, b-12, b-16, c-3, i c-4. Як результат, всі сполуки проявляють принаймні 75 % захисну дію.

5 (Приклад біологічного тесту 3) Тест занурення на шийкову гниль рису

Рисові саджанці вирощені в комерційно доступних горщиках обсипали для забезпечення умов занурення (Сорт "koshihikari", 1 листок) і наливали на поверхню води емульсією сполуки згідно з представленим винаходом з концентрацією активного інгредієнта 400 м.ч.. Через 2 дні, інокулювали розпиленням суспензії бактерій шийкової гнилі рису (*Magnaporthe grisea*), витримували 2 дні в кімнаті в темній кімнаті при 25°C при високій вологості, і потім витримували 8 днів в кімнаті з 25°C, де світло і темряву змінювали кожні 12 годин. Визначали контролюючу дію за наступною шкалою порівнюючи зовнішній стан пошкоджень на листі з необробленими.

15 А (принаймні 60 % захисна дія)

В (принаймні 40 %, але менше ніж 60 % захисна дія)

Як результат представленої тесту, контролююча дія наступних сполук була оцінена як А.

Сполука з номером: 5, 20, 21, 23, 25, 28, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 43, 44, 48, 58, 66, 70, 71, 73, 78, 84, 85, 88, 89, 90, 106, 107, 227, 228, 234, 236, 260, 262, 348, 353, 356, 358, 375, 376, 401, 402, a-6

20 Також, контролююча дія наступних сполук була оцінена як В.

Сполука з номером: 1, 3, 7, 12, 13, 22, 46, 54, 55, 75, 95, 98, 139, 151, 261, 359, 360, b-1

(Приклад біологічного тесту 4) Тест занурення на шийкову гниль рису

Рисові саджанці вирощені в комерційно доступних горщиках обсипали для забезпечення умов занурення (Сорт "koshihikari", 1 листок) і наливали на поверхню води емульсією сполуки згідно з представленим винаходом з концентрацією активного інгредієнта 400 м.ч.. Через 14 днів, інокулювали розпиленням суспензії бактерій шийкової гнилі рису (*Magnaporthe grisea*), витримували 2 дні в кімнаті в темній кімнаті при 25°C при високій вологості, і потім витримували 8 днів в кімнаті з 25°C, де світло і темряву змінювали кожні 12 годин. Визначали контролюючу дію за наступною шкалою порівнюючи зовнішній стан пошкоджень на листі з необробленими.

30 А (принаймні 60 % захисна дія)

В (принаймні 40 %, але менше ніж 60 % захисна дія)

Як результат представленої тесту, контролююча дія наступних сполук була оцінена як А.

Сполука з номером: 21, 36, 37, 38, 43, 44, 48, 84, 88, 89, 95, 106, 109, 125, 262, 266, 267, 292, 350, 375, a-6

35 Також, контролююча дія наступних сполук була оцінена як В.

Сполука з номером: 236

(Приклад біологічного тесту 5) Протруєння насіння від в'янення огірка

Насіння огірка (Сорт "Cucumis sativus L.") заражене бактерією в'янення насіння (*Fusarium oxysporum*) обробляли емульсією сполуки згідно з представленим винаходом одержуючи насіння, що містить 1 г/кг активного інгредієнта. Насіння висаджували і через 3 тижні визначали контролюючу дію порівнюючи ступінь проявлення захворювання з необробленими.

Як результат, наступні сполуки проявляють відмінну захисну дію принаймні 75 %.

Сполука з номером: 18, 36, 37, 43, 44, 48, 77, 81, 83, 88, 92, 94, 100, 103, 109, 126, 225, 227, 228, 234, 235, 241, 242, 243, 244, 252, 258, 266, 268, 298, 395, 397, 425, 435, a-6, a-7, a-8, b-8, b-12, c-4

45 (Приклад біологічного тесту 6) Протруєння насіння від в'янення огірка

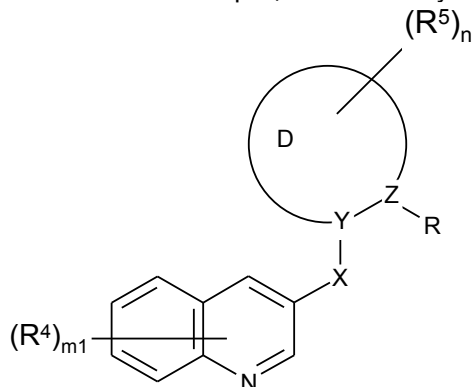
Насіння огірка (Сорт "Cucumis sativus L.") обробляли емульсією сполуки згідно з представленим винаходом одержуючи насіння, що містить 1 г/кг активного інгредієнта. Насіння висаджували в ґрунт, що містить бактерію в'янення огірка (*Fusarium oxysporum*) і через 3 тижні визначали контролюючу дію порівнюючи ступінь проявлення захворювання з необробленими.

Як результат, наступні сполуки проявляють відмінну захисну дію принаймні 75 %.

Сполука з номером: 17, 18, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 43, 86, 88, 96, 97, 100, 109, 227, 232, 239, 242, 243, 244, 262, 265, 268, 295, 296, 375, 428, a-7, b-1.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (II):



де, у Формулі (II), R представляє групу, представлену $CR^1R^2R^3$;

R^1 , R^2 і R^3 кожен незалежно представляє атом водню, незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену C_{4-8} циклоалкенільну групу, незаміщену C_{6-10} арильну групу, незаміщену гетероциклічну групу, незаміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, незаміщену або заміщену карбоксильну групу, незаміщену або заміщену карбамоїльну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, незаміщену або заміщену аміногрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

за винятком, коли: R^1 , R^2 і R^3 всі є атомами водню; R^1 , R^2 і R^3 всі є незаміщеними C_{1-8} алкільними групами; будь-який один з R^1 , R^2 і R^3 є атом водню і два, що залишились, обидва є незаміщеними C_{1-8} алкільними групами; і будь-який один з R^1 , R^2 і R^3 є незаміщеною C_{1-8} алкільною групою і два, що залишились, обидва є атомами водню;

R^1 і R^2 можуть бути зв'язані, утворюючи $O=$;

R^4 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

m^1 представляє кількість R^4 і є цілим числом від 0 до 6;

R^5 кожен незалежно представляє незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

n представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 5;

D представляє 5-7-членне вуглеводневе кільце або 5-7-членне гетероциклічне кільце;

X представляє атом кисню;

Y представляє атом вуглецю; і

Z представляє атом вуглецю, і

заміщена C_{1-8} алкільна група є C_{3-6} циклоалкіл C_{1-6} алкільною групою, C_{4-6} циклоалкеніл C_{1-6} алкільною групою, C_{1-6} галоалкільною групою, C_{6-10} арил C_{1-6} алкільною групою, 5-6-членний гетероарил C_{1-6} алкільною групою, гідроксил C_{1-6} алкільною групою, C_{1-6} алкоксил C_{1-6} алкільною групою, C_{1-7} ацилоксил C_{1-6} алкільною групою, три C_{1-6} алкілсилілоксил C_{1-6} алкільною групою, C_{1-6} алкілзаміщеною C_{6-10} арилсульфонілоксил C_{1-6} алкільною групою, ціано C_{1-6} алкільною групою, C_{1-6} ацил C_{1-6} алкільною групою, 2-гідроксііміно C_{2-6} алкільною групою, форміл C_{1-6} алкільною групою, карбоксил C_{1-6} алкільною групою, C_{1-6} алкоксикарбоніл C_{1-6} алкільною групою або азидо C_{1-6} алкільною групою,

заміщена карбоксильна група є C_{1-6} алкоксикарбонільною групою, C_{2-6} алкенілоксикарбонільною групою, C_{2-6} алкінілоксикарбонільною групою, C_{6-10} арилоксикарбонільною групою або C_{6-10} арил C_{1-6} алкоксикарбонільною групою,

заміщена карбамоїльна група є моно C_{1-6} алкілкарбамоїльною групою, ді C_{1-6} алкілкарбамоїльною групою або моно C_{6-10} арилкарбамоїльною групою,

заміщена гідроксильна група є C_{1-6} алкоксигрупою, C_{3-8} циклоалкіл C_{1-6} алкоксигрупою,

C_{6-10} арил C_{1-6} алкоксигрупою, C_{1-6} галоалкоксигрупою, C_{2-6} алкенілоксигрупою,

C_{2-6} алкінілоксигрупою, C_{3-6} циклоалкілоксигрупою, C_{6-10} арилоксигрупою,

C_{6-10} арил C_{1-6} алкілоксигрупою, C_{1-7} ацилоксигрупою, C_{1-6} алкоксикарбоніл C_{1-6} алкоксигрупою або три C_{1-6} алкілсилілоксигрупою, і

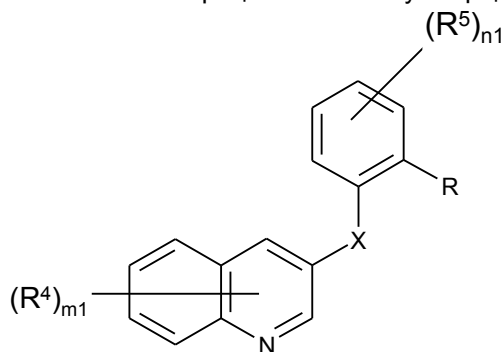
заміщена аміногрупа є моно C_{1-6} алкіламіногрупою, ді C_{1-6} алкіламіногрупою, моно C_{1-6} алкіліденаміногрупою, моно C_{6-10} ариламіногрупою, ді C_{6-10} ариламіногрупою, C_{6-10} арил C_{1-6} алкіламіногрупою, C_{1-6} ациламіногрупою або C_{1-6} алкоксикарбоніламіногрупою, або її сіль або N-оксид сполуки.

5 2. Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки за пунктом 1, де R^1 представляє незаміщену або заміщену гідроксильну групу, R^2 представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу і R^3 представляє атом водню або незаміщену або заміщену C_{1-8} алкільну групу, незаміщену C_{2-8} алкенільну групу, незаміщену C_{2-8} алкінільну групу, незаміщену C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{6-10} арильну групу, незаміщену гетероциклічну групу, 10 незаміщену C_{1-8} ацильну групу, незаміщену (1-іміно) C_{1-8} алкільну групу, C_{1-6} алкоксикарбонільну групу, незаміщену або заміщену гідроксильну групу або ціаногрупу.

3. Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки за пунктом 1 або 2, де R^4 представляє C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} галогеналкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, гідроксильну групу, C_{1-6} алкоксигрупу або галоген.

15 4. Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки за будь-яким з пунктів 1-3, де R^5 представляє C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} галогеналкільну групу, C_{6-10} арил C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{1-6} алкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

5. Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки за будь-яким з пунктів 1-4, де азотвмісна гетероциклічна сполука представлена Формулою (III):



20 де кожен з R , R^4 , R^5 , $m1$ і X має таке ж саме значення як ті, що наведені у Формулі (II); і $n1$ представляє кількість R^5 і є цілим числом від 0 до 4.

6. Азотвмісна гетероциклічна сполука, її сіль або N-оксид сполуки за пунктом 5, де азотвмісна гетероциклічна сполука є 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]-3,3-диметилбутан-2-олом, 25 2-[2-фтор-6-(8-фторхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олом, 2-[2-фтор-6-(8-фтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олом або 2-[2-фтор-6-(7,8-дифтор-2-метилхінолін-3-ілокси)феніл]пропан-2-олом.

7. Сільськогосподарський фунгіцид, що містить як активний інгредієнт принаймні одну сполуку, 30 вибрану з групи, яка містить азотвмісну гетероциклічну сполуку, її сіль і N-оксид сполуки за будь-яким одним з пунктів 1-6.

Комп'ютерна верстка Л. Литвиненко

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601