



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **100520** (13) **C2**
(51) МПК (2013.01)
C07D 231/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01P 3/00

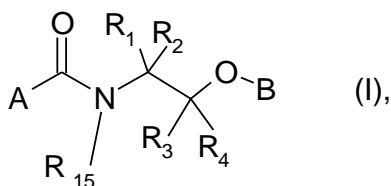
ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: а 2010 01775	(72) Винахідник(и): Штірлі Даніель (CH), Дайна Антуан (CH), Вальтер Харальд (DE/CH), Тоблер Ханс (CH), Раджан Рамія (IN)
(22) Дата подання заявки: 24.07.2008	(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 10.01.2013	(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 1581/DEL/2007, 1867/DEL/2007	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: EP 0 405 808, A, 02.01.1991 JP 2001342179, A, 11.12.2001 JP 2001342180, A, 11.12.2001 JP 3153668, A, 01.07.1991 JP 2001342183, A, 11.12.2001 JP 6056611. A, 01.03.1994 JP 7089937. A, 04.04.1995 WO 0191558, A, 06.12.2001 WO 02051822, A, 04.07.2002 WO 03004474, A, 16.01.2003
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 26.07.2007, 03.09.2007	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: IN, IN	
(41) Публікація відомостей про заявку: 25.06.2010, Бюл.№ 12	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.01.2013, Бюл.№ 1	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: РСТ/EP2008/006091, 24.07.2008	

(54) ПОХІДНІ ЕТИЛОКСІАМІДУ ТА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ БОРОТЬБИ І ЗАХІСТУ ВІД ЗАРАЖЕННЯ ФІТОПАТОГЕННИМИ МІКРООРГАНІЗМАМИ**(57) Реферат:**

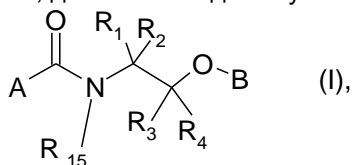
Похідні етилоксиаміду формули I, в якій замісники є такими, як визначено у п. 1 формули винаходу, та композиція для боротьби і захисту від зараженням фітопатогенними мікроорганізмами.

**UA 100520 C2**

Даний винахід стосується нових мікробіоцидно активних, зокрема, фунгіцидно активних етиламідів. Даний винахід також стосується проміжних продуктів, що використовуються при одержанні цих сполук, композицій, які містять ці сполуки, і їх застосування в сільському господарстві або садівництві для боротьби із зараженням рослин фітопатогенними мікроорганізмами, бажано - грибами, або його попередження.

Аналогічні сполуки також відомі в інших областях техніки, наприклад, застосування аміноацетонітрилів в якості інсектицидів описано у WO 03/004474.

Згідно винаходу встановлено, що нові етилоксиаміди мають мікробіоцидну активність. Таким чином, даний винахід стосується сполук формули I



в якій

A означає 5-членне гетероциклічне кільце, що містить від 1 до 3 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний з групи, що включає кисень, азот і сірку, гетероциклічне кільце заміщено групами R₅, R₆ і R₇;

R₅, R₆ і R₇ кожний незалежно означає водень, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄-алкіл) або C₁-C₄-галогеналкокси-(C₁-C₄-алкіл) за умови, що принаймні один з R₅, R₆ і R₇ не означає водень;

R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₁-C₆-алкоксигрупу, C₁-C₆-галогеналкоксигрупу, C₁-C₆-алкілтіогрупу або C₁-C₆-галогеналкілтіогрупу;

або R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп;

або R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп;

або R₃ і R₄ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп;

R₁₅ означає водень або C₃-C₇-циклоалкіл;

B означає феніл, нафтил або 5-10-члену гетероароматичну кільцеву систему, що містить від 1 до 3 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний з групи, що включає кисень, азот і сірку, феніл, нафтил або 5-10-члена гетероароматична кільцева система заміщена однією або більшою кількістю груп R₈;

кожний замісник R₈ незалежно один від одного означає галоген, C₁-C₆-алкоксигрупу, -C(O)N, C₁-C₆-алкілкарбоніл, аміногрупу, C₁-C₆-алкіламіногрупу, ді-C₁-C₆-алкіламіногрупу, C₁-C₆-алкілкарбоніламіногрупу, C₁-C₆-галогеналкоксигрупу, C₁-C₆-галогеналкілтіогрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, -C(R^a)=N(OR^b), -N=C(R^e)-N(R^f)₂,

C₁-C₆-алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉,

C₂-C₆-алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉,

C₂-C₆-алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉,

C₂-C₆-алкенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R₉,

C₃-C₆-циклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉,

C₆-C₁₄-біциклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉,

феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R₉, або

фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R₉;

кожний R₉ незалежно один від одного означає галоген, нітрогрупу, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу, C₁-C₆-галогеналкоксигрупу, C₁-C₆-алкілтіогрупу, C₁-C₆-галогеналкілтіогрупу, C₃-C₆-алкенілоксигрупу, C₃-C₆-алкінілоксигрупу, феніл, галогенфеніл, три-C₁-C₆-алкілсиліл або -C(R^c)=N(OR^d);

кожний R^a, R^c, R^e і R^f незалежно один від одного означає водень або C₁-C₆-алкіл;

кожний R^b і R^d незалежно один від одного означає C₁-C₆-алкіл;

і таутомерів/ізомерів/енантіомерів цих сполук.

Алкільні групи, що містяться у визначеннях замісників, можуть мати лінійний або розгалужений ланцюг і являють собою, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, н-гексил, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, ізобутил або трет-бутил. Алкоксильні, алкенільні і алкінільні радикали утворені з вказаних алкільних радикалів. Алкенільні і алкінільні групи

можуть бути моно-або диненасиченими.

У контексті даного винаходу вираз "щомістить один або більшу кількість замісників" у визначенні замісників залежно від хімічної структури замісників звичайно означає від моно- до семикратнозаміщеного, бажано від моно- до п'ятикратнозаміщеного, більш бажано - моно-, ди- або тризаміщений.

Циклоалкільні групи, що містяться у визначеннях замісників, являють собою, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил.

Галоген зазвичай означає фтор, хлор, бром або йод, бажано - фтор, бром або хлор. Це також стосується комбінацій галогену з іншими значеннями, таким як галогеналкіл або галогеналкоксигрупа.

Галогеналкільні групи бажано містять в ланцюзі від 1 до 4 атомів вуглецю. Галогеналкіл являє собою, наприклад, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторетил, 2-фторетил, 2-хлоретил, пентафторетил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлоретил, 2,2,3,3-тетрафторетил або 2,2,2-трихлоретил; бажано - трихлорметил, дифторхлорметил, дифторметил, трифторметил або дихлорфторметил.

Алкоксигрупа являє собою, наприклад, метоксигрупу, етоксигрупу, пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, н-бутоксигрупу, ізобутоксигрупу, втор-бутоксигрупу і трет-бутоксигрупу; бажано - метоксигрупу і етоксигрупу. Галогеналкоксигрупа являє собою, наприклад, фторметоксигрупу, дифторметоксигрупу, трифторметоксигрупу, 2,2,2-трифторетоксигрупу, 1,1,2,2-тетрафторетоксигрупу, 2-фторетоксигрупу, 2-хлоретоксигрупу, 2,2-дифторетоксигрупу і 2,2,2-трихлоретоксигрупу; бажано - дифторметоксигрупу, 2-хлоретоксигрупу і трифторметоксигрупу.

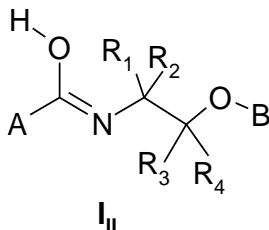
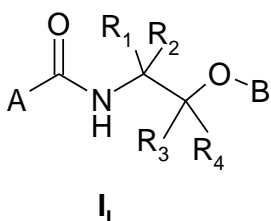
Алкоксиалкіл являє собою, наприклад, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, н-пропоксиметил, н-пропоксиетил, ізопропоксиметил або ізопропоксиетил.

Галогенфеніл бажано являє собою феніл, заміщений 1, 2 або 3 атомами галогенів, наприклад, 4-хлорфеніл.

R_{15} в якості C_3 - C_7 -циклоалкілу являє собою циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил або циклогептил, бажано циклопропіл.

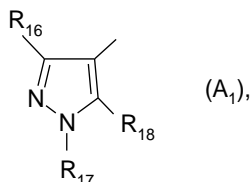
У контексті даного винаходу "5- або 6-членне гетероциклічне кільце, що містить від 1 до 3 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний з групи, що включає кисень, азот і сірку" бажано означає піразоліл (бажано - піразол-4-іл), тіазоліл (бажано - тіазол-5-іл), піроліл (бажано - пірол-3-іл), 1,2,3-тріазоліл, оксазоліл (бажано - оксазол-5-іл), піридил (бажано - пірид-3-іл) або 2,3-дигідро-[1,4]оксатиініл (бажано - 2,3-дигідро-[1,4]оксатиін-5-іл).

Сполуки формули I можуть існувати в різних ізомерних формах; в обсяг даного винаходу входять всі ці ізомери і їх суміші. Сполуки формули I можуть існувати в різних таутомерних формах. Наприклад, сполуки формули I, в якій R_{15} означає водень, існують у таутомерних формах I_I і I_{II}:



В обсяг даного винаходу входять всі ці таутомерні форми та їх суміші.

У бажаній групі сполук А означає A_1



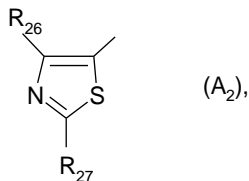
де

R_{16} означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галогеналкокси- C_1 - C_4 -алкіл;

R_{17} означає C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галогеналкокси- C_1 - C_4 -алкіл; і

R_{18} означає водень, галоген або ціаногрупу;

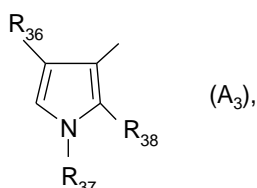
або А означає А₂



де

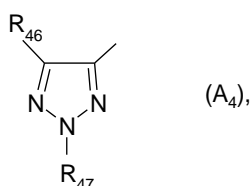
- 5 R₂₆ означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкокси-С₁-С₄-алкіл; і
R₂₇ означає С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкокси-С₁-С₄-алкіл;

або А означає А₃



де

- 10 R₃₆ означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкокси-С₁-С₄-алкіл;
R₃₇ означає С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкокси-С₁-С₄-алкіл; і
15 R₃₈ означає водень, галоген або ціаногрупу;
або А означає А₄



де

- 20 R₄₆ і R₄₇ незалежно один від одного означають галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-галогеналкіл, С₁-С₄-галогеналкоксигрупу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкокси-С₁-С₄-алкіл.

Крім того, бажано, якщо у зазначеній бажаній групі сполук А означає А₁.

Крім того, бажано, якщо у зазначеній бажаній групі сполук А означає А₂.

Крім того, бажано, якщо у зазначеній бажаній групі сполук А означає А₃.

- 25 Крім того, бажано, якщо у зазначеній бажаній групі сполук А означає А₄.

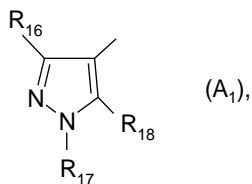
В особливо бажаній групі сполук А означає А₁, де R₁₈ означає водень. В іншій особливо бажаній групі сполук А означає А₁, де R₁₆ означає С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкіл, бажано С₁-С₄-галогеналкіл; ще більш бажано, якщо R₁₆ вибраний з групи, що включає CF₂H і CF₃; R₁₇ означає С₁-С₄-алкіл; бажано метил; і R₁₈ означає водень або галоген, бажано водень. В одному варіанті здійснення R₁₆ означає CF₂H, R₁₇ означає метил і R₁₈ означає водень.

- 30 В іншій особливо бажаній групі сполук А означає А₂, де R₂₆ означає С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкіл; і R₂₇ означає С₁-С₄-алкіл.

У ще одній особливо бажаній групі сполук А означає А₃, де R₃₆ означає С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкіл; R₃₇ означає С₁-С₄-алкіл; і R₃₈ означає водень або галоген.

- 35 У ще одній особливо бажаній групі сполук А означає А₄, де R₄₆ означає С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галогеналкіл; і R₄₇ означає С₁-С₄-алкіл.

У ще одній особливо бажаній групі сполук А означає А₄, де R₄₆ означає галогенметил, бажано, якщо R₄₆ вибраний з групи, що включає CF₃, CF₂H і CFH₂; і R₄₇ означає С₁-С₄-алкіл.



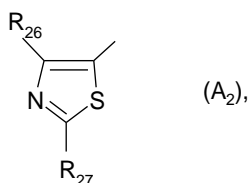
де

R₁₆ означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл;

5 R₁₇ означає C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл; і

R₁₈ означає водень, галоген або ціаногрупу;

або A означає A₂

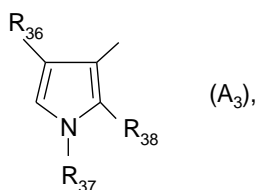


де

R₂₆ означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл; і

10 R₂₇ означає C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл;

15 або A означає A₃



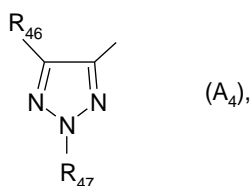
де

R₃₆ означає галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл;

20 R₃₇ означає C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл; і

R₃₈ означає водень, галоген або ціаногрупу;

або A означає A₄



де

25 R₄₆ і R₄₇ незалежно один від одного означають галоген, ціаногрупу, нітрогрупу, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-галогеналкоксигрупу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галогеналкокси-C₁-C₄-алкіл.

30 У бажаній групі сполук R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень або C₁-C₆-алкіл; або R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу; або R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу; або R₃ і R₄ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу.

В іншій бажаній групі сполук R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень або C₁-C₆-алкіл; більш бажано, якщо R₁ і R₂ незалежно один від одного означають C₁-C₆-алкіл; і R₂ і R₄ кожний означає водень. У ще одній бажаній групі сполук R₁ означає C₁-C₆-алкіл, бажано - метил; і R₂, R₃ і R₄ кожний означає водень.

35 У ще одній бажаній групі сполук R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, бажано - етилен; і R₃ і R₄ обидва означають водень.

У ще одній бажаній групі сполук R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, бажано -

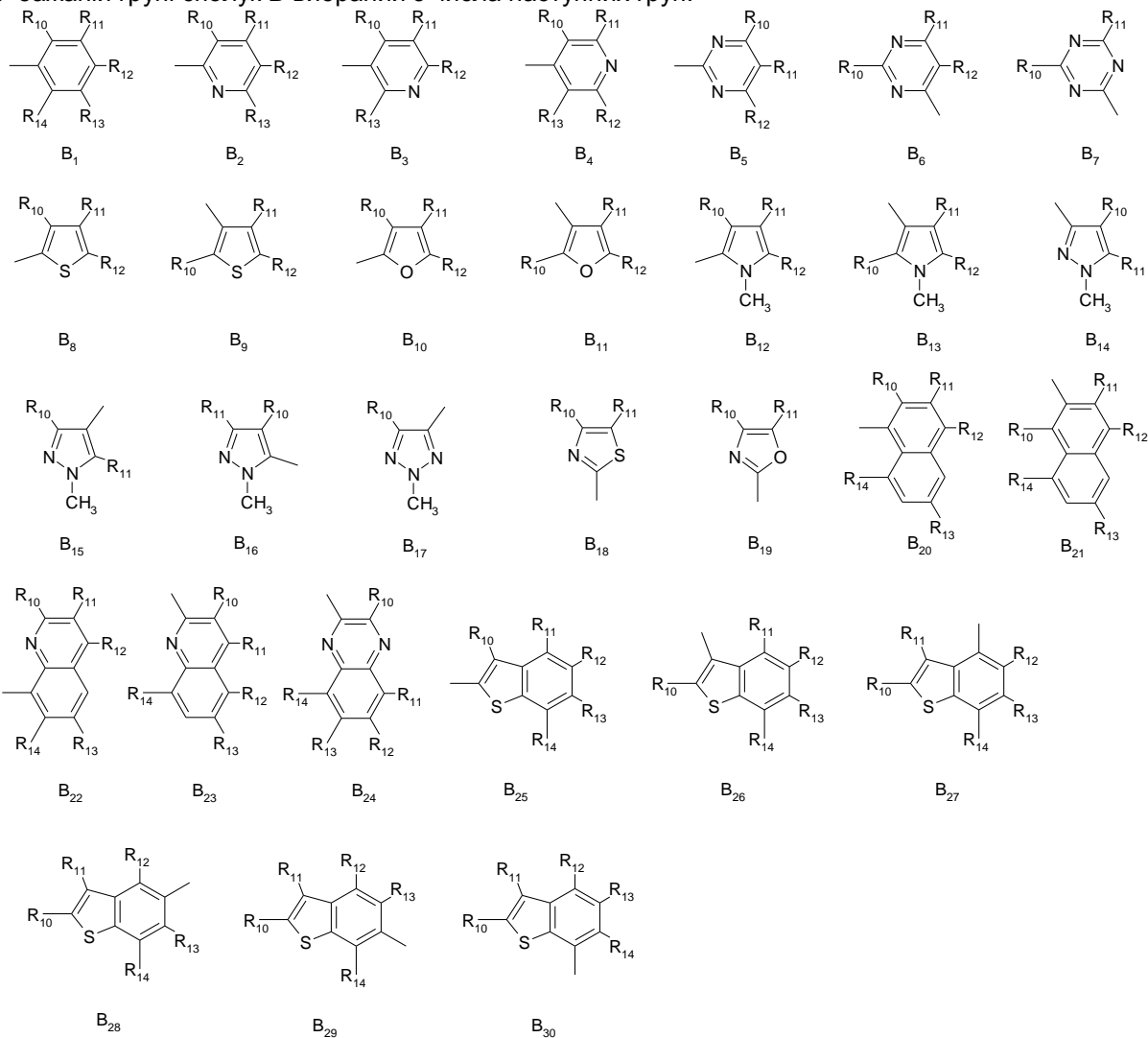
метилен; і R_2 і R_4 обидва означають водень.

У ще одній бажаній групі сполук R_1 , R_2 , R_3 і R_4 кожний означає водень.

Бажано, якщо R_{15} означає водень.

- 5 У бажаній групі сполук В означає феніл, нафтил або 5-, 6-, 9- або 10-члену гетероароматичну кільцеву систему, що містить від 1 до 3 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний з групи, що включає кисень, азот і сірку, феніл, нафтил або 5-, 6-, 9- або 10-члена гетероароматична кільцева система заміщеною однією або більше груп R_8 ;

У бажаній групі сполук В вибраний з числа наступних груп:



- 10 в яких R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, $-C(O)H$, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, аміногрупу, C_1 - C_6 -алкіламіногрупу, ді- C_1 - C_6 -алкіламіногрупу, C_1 - C_6 -алкілкарбоніламіногрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, $-N=C(R^e)-N(R^f)_2$,
 15 C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,
 C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,
 C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,
 C_2 - C_6 -алкенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ,
 C_3 - C_6 -циклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,
 C_6 - C_{14} -біциклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,
 20 феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , або
 фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ;
 кожний R_9 незалежно один від одного означає галоген, нітрогрупу, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -алкілтіогрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, C_3 - C_6 -алкенілоксигрупу, C_3 - C_6 -алкінілоксигрупу, феніл, галогенфеніл, три- C_1 - C_6 -алкілсиліл або
 25 $C(R^c)=N(OR^d)$;
 кожний R^a , R^c , R^e і R^f незалежно один від одного означає водень або C_1 - C_6 -алкіл;

кожний R^b і R^d незалежно один від одного означає C_1 - C_6 -алкіл;

за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} не означає водень.

Бажано, якщо R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ; і кожний R_9 незалежно один від одного означає галоген або C_1 - C_6 -алкоксигрупу; за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} не означає водень.

Більш бажано, якщо R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} не означає водень.

У бажаній групі сполук В вибраний з групи, що включає B_1 , B_2 , B_3 , B_4 , B_{20} , B_{21} , B_{22} , B_{23} , B_{24} , B_{25} , B_{26} , B_{27} , B_{28} , B_{29} і B_{30} . Більш бажано, якщо В вибраний з групи, що включає B_1 , B_2 , B_3 , B_4 , B_{20} , B_{21} , B_{22} , B_{23} і B_{24} . Ще більш бажано, якщо В означає B_1 , B_2 , B_3 або B_4 . В одному варіанті здійснення В означає B_1 .

В іншому варіанті здійснення В означає B_2 , B_3 або B_4 . У ще одному варіанті здійснення В означає B_2 . У ще одному варіанті здійснення В означає B_3 . У ще одному варіанті здійснення В означає B_4 .

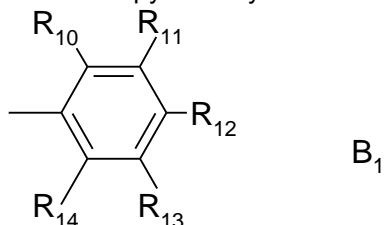
У ще одному варіанті здійснення В означає B_{20} , B_{21} , B_{22} , B_{23} або B_{24} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{20} або B_{21} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{20} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{21} .

У ще одному варіанті здійснення В означає B_{22} , B_{23} або B_{24} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{22} .

У ще одному варіанті здійснення В означає B_{23} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{24} .

У ще одному варіанті здійснення В означає B_{25} , B_{26} , B_{27} , B_{28} , B_{29} або B_{30} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{25} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{26} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{27} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{28} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{29} . У ще одному варіанті здійснення В означає B_{30} .

У бажаній групі сполук В означає B_1



де R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, $-C(O)H$, C_1 - C_6 -алкілкарбоніл, аміногрупу, C_1 - C_6 -алкіламіногрупу, ді- C_1 - C_6 -алкіламіногрупу, C_1 - C_6 -алкілкарбоніламіногрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, $-N=C(R^e)-N(R^f)_2$,

C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,

C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,

C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,

C_2 - C_6 -алкенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ,

C_3 - C_6 -циклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ,

C_6 - C_{14} -біциклоалкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , або

феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , або

фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ;

кожний R_9 незалежно один від одного означає галоген, нітрогрупу, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -алкілтіогрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, C_3 - C_6 -алкенілоксигрупу, C_3 - C_6 -алкінілоксигрупу, феніл, галогенфеніл, три- C_1 - C_6 -алкілсиліл або $-C(R^c)=N(OR^d)$;

кожний R^a , R^c , R^e і R^f незалежно один від одного означає водень або C_1 - C_6 -алкіл;

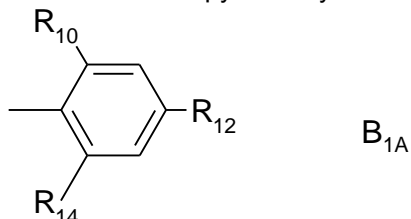
кожний R^b і R^d незалежно один від одного означає C_1 - C_6 -алкіл;

за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} не означає водень.

У бажаній групі сполук В означає B_1 , де R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією

або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ; фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ; і кожний R_9 незалежно один від одного означає

- 5 галоген або C_1 - C_6 -алкоксигрупу;
за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} не означає водень.
В іншій бажаній групі сполук В означає B_{1A}



- де R_{10} , R_{12} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ; фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ; і кожний R_9 незалежно один від одного означає галоген або C_1 - C_6 -алкоксигрупу; за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{12} і R_{14} не означає водень.

Також бажаними є сполуки, в яких В означає B_{1A} , де R_{10} , R_{12} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; за умови, що принаймні один з R_{10} , R_{12} і R_{14} не означає водень.

- 20 В одному варіанті здійснення R_{10} і R_{12} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{14} означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

В іншому варіанті здійснення R_{10} і R_{12} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{14} означає водень.

- 25 У ще одному варіанті здійснення R_{10} , R_{12} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

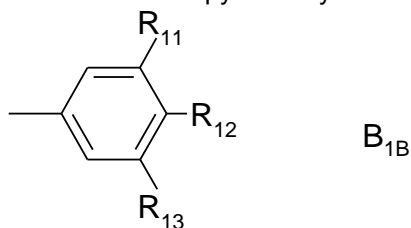
У ще одному варіанті здійснення R_{10} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{12} означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

- 30 У ще одному варіанті здійснення R_{10} і R_{14} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{12} означає водень.

У ще одному варіанті здійснення R_{10} означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{12} і R_{14} обидва означають водень.

- 35 У ще одному варіанті здійснення R_{12} означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{10} і R_{14} обидва означають водень.

В іншій бажаній групі сполук В означає B_{1B}



- де R_{11} , R_{12} і R_{13} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу, $-C(R^a)=N(OR^b)$, C_1 - C_6 -алкіл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкеніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , C_2 - C_6 -алкініл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 , феніл, який є незаміщеним або заміщеним однією або більше груп R_9 ; фенілоксигрупу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше груп R_9 ; і кожний R_9 незалежно один від одного означає галоген або C_1 - C_6 -алкоксигрупу; за умови, що принаймні один з R_{11} , R_{12} і R_{13} не означає водень.

Також бажаними є сполуки, в яких В означає B_{1B} , де R_{11} , R_{12} і R_{13} кожний незалежно один від одного означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; за умови, що принаймні

один з R_{11} , R_{12} і R_{13} не означає водень.

В одному варіанті здійснення R_{11} і R_{13} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{12} означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

5 В іншому варіанті здійснення R_{11} і R_{13} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{12} означає водень.

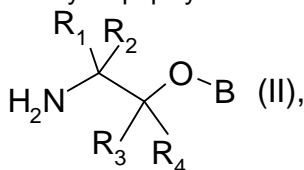
В іншому варіанті здійснення R_{11} і R_{12} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл; і R_{13} означає водень.

10 В іншому варіанті здійснення R_{11} , R_{12} і R_{13} кожний незалежно один від одного означає галоген, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галогеналкіл.

Якщо R_1 не означає R_2 , то бажаним є S-енантіомер.

Одержання сполук формули I, в якій R_{15} означає водень, описано нижче. Сполуки формули I, в якій R_{15} означає C_3 - C_7 -циклоалкіл, можна одержати аналогічно.

Сполуки формули I можна одержати за реакцією сполуки формули II



15

в якій B, R_1 , R_2 , R_3 і R_4 є такими, як визначено для формули I; зі сполукою формули III

$A-C(=O)-R^*$ (III),

в якій A є таким, як визначено для формули I, і R^* означає галоген, гідроксигрупу або C_1 - C_6 -алкоксигрупу, бажано хлор, за присутності основи, такої як триетиламін, основа Хьюніга, бікарбонат натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин або хінолін, але бажано триетиламін, і у розчиннику, такому як діетиловий ефір, ТБМЕ (трет-бутилметиловий ефір), ТГФ (тетрагідрофуран), дихлорметан, хлороформ, ДМФ (диметилформамід) або NMP (N-метилпіролідон), протягом від 10 хв до 48 год., бажано від 12 до 24 год. і при температурі от 0 °C до температури кипіння, бажано від 20 до 25 °C.

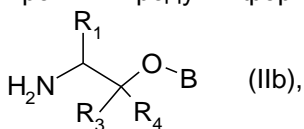
25

Якщо R^* означає гідроксигрупу, то можна використовувати реагент сполучення, такий як бензотриазол-1-ілокситрис(диметиламіно)фосфонійгексафторфосфат, хлорангідрид біс-(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфінової кислоти (BOP-Cl), N, N'-дициклогексилкарбодіїмід (ДЦК) або 1,1'-карбонілдіїмідазол (КДІ).

30

Проміжні продукти формули II, в якій B, R_1 , R_2 , R_3 і R_4 є такими, як визначено для формули I; можна одержати відповідно до наведених нижче схем реакцій (схеми 1-5) або за аналогією із цими схемами реакцій.

Проміжні продукти формули IIb

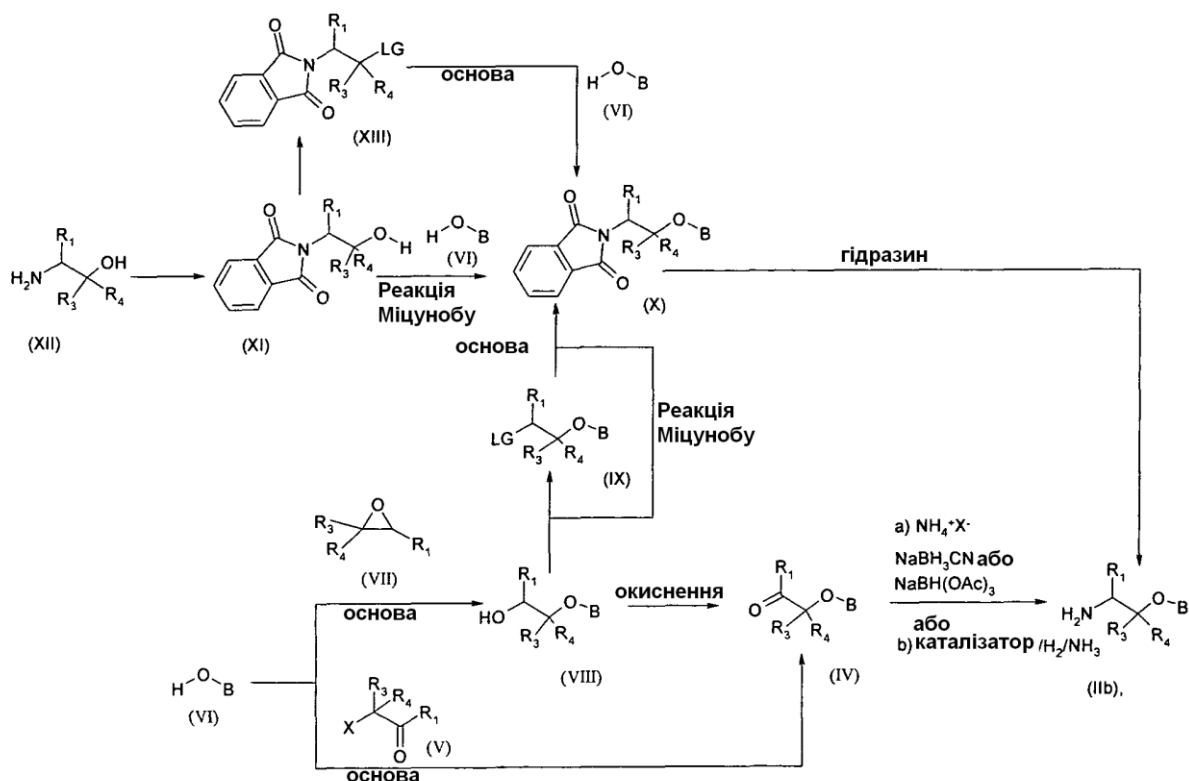


35

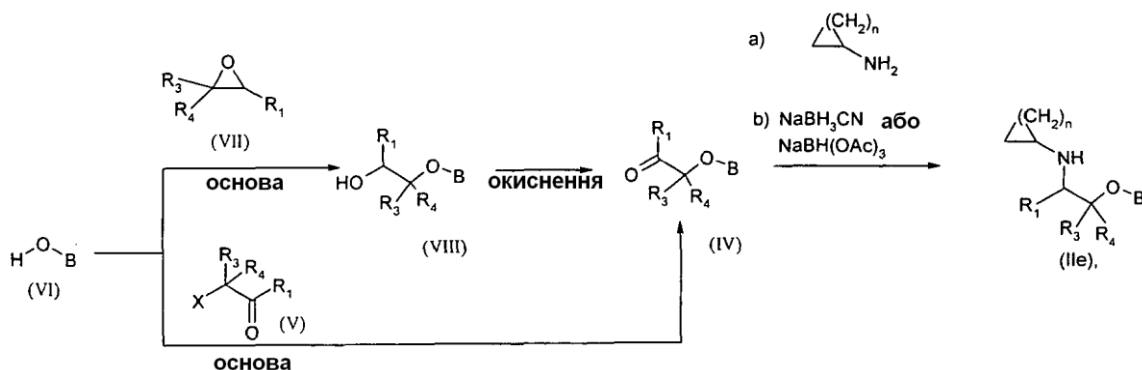
в якій B є таким, як визначено для формули I, і R_1 , R_3 і R_4 незалежно один від одного означають водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галогеналкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галогеналкініл, C_1 - C_6 -алкоксигрупу, C_1 - C_6 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 -алкілтіогрупу або C_1 - C_6 -галогеналкілтіогрупу; або R_1 і R_3 разом означають C_2 - C_5 -алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C_1 - C_6 -алкільних груп; або R_3 і R_4 разом означають C_2 - C_5 -алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C_1 - C_6 -алкільних груп; можна одержати, як показано на схемі реакцій 1.

40

Схема 1:



Проміжні продукти формули IIe, в якій R₁₅ означає C₃-C₇-циклоалкіл можна, наприклад, одержати, як показано на схемі 1a:



На схемі 1a n дорівнює 1, 2, 3, 4 або 5. Аналогічні методики одержання сполуки формули IIe, в якій R₁₅ означає C₃-C₇-циклоалкіл, описані в публікації J. Het. Chem., 1983, p.1031-6; J. Am. Soc., 2004, p5192-5201 і Synth. Commun. 2003, p3419-25.

Проміжні продукти формули IV, в якій B, R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, можна одержати за реакцією Вільямсона гідроксилохідної формули VI, в якій B є таким, як визначено для формули IIb, с α-галогенкарбонільною сполукою формули V, в якій R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb. Зазначену реакцію алкілювання можна провести за присутності основи. Придатні основи включають гідроксиди і/або карбонати металів, такі як гідроксид літію, карбонат цезію, карбонат калію, гідроксид калію, гідроксид натрію або гідриди металів, такі як гідрид натрію і гідрид літію або фторид цезію. Придатні розчинники включають кетони, такі як ацетон і метилетилкетон, і інші розчинники, такі як N, N-диметилформамід, диметилацетамід, і нітрили, такі як ацетонітрил і пропіонітрил. Температура проведення реакції може змінюватися в широких межах, але звичайно вона перебуває в діапазоні від температури навколишнього середовища до температури кипіння реакційної суміші

Аміни формули IIb потім можна одержати зі сполук формули IV відновлювальним амінуванням надлишком галогеніду амонію (X⁻ означає галогенід-іон) або ацетату (X⁻ означає

ацетат) за присутності 1-10 екв. гібридного відновлювального реагенту, такого як тетрабутилцианоборогідрид натрію або триацетоксидоборогідрид натрію. Реакцію можна провести у протонних розчинниках, таких як спирти метанол, етанол, ізопропанол, трет-бутанол і т. п., або в апротонних розчинниках, таких як тетрагідрофуран або дихлорметан. Кислотний каталізатор, такий як HCl або п-толуолсульфонову кислоту, можна додати порціями для підтримки значення pH рівним 3-5 за даними визначення за допомогою pH-метра або індикаторного барвника, такого як бромкрезоловий зелений або метиловий жовтогогарячий. Температура проведення реакції звичайно перебуває у діапазоні від -5 до 60 °C.

Спирти формули VIII, в якій B, R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, можна одержати шляхом розкриття циклу епоксиду формули VII, в якій R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, з використанням гідроксипохідної формули VI. Реакцію розкриття циклу можна провести за присутності каталізатора. Придатні каталізатори включають основи, такі як аміни, такі як піридин, триетаноламін і т. п., або гідроксиди і/або карбонати металів, такі як гідроксид літію, карбонат цезію, карбонат калію, гідроксид калію, гідроксид натрію або гібриди металів, такі як гібрид натрію і гібрид літію або фторид цезію, а також кислоти Льюїса, такі як тетраметиламонійфторид. Придатні розчинники включають спирти, такі як етанол, ізопропанол, трет-бутанол і т. п., кетони, такі як ацетон і метилетилкетон, і інші розчинники, такі як N, N-диметилформамід, диметилацетамід і нітрили, такі як ацетонітрил і пропіонітрил. Температура проведення реакції може змінюватися у широких межах, але звичайно вона перебуває в діапазоні від температури навколишнього середовища до температури кипіння реакційної суміші.

Проміжні кетони формули IV потім можна одержати окисненням відповідних спиртів формули VIII. Бажані методики окиснення можуть бути засновані на сірковміщуючих окисних реагентах (у літературі такі реакції називають окисненням по Згорну або окисненням по Пфайзеру-Моффату), металвміщуючих окисних реагентах або пероксидах водню за присутності металвміщуючих каталізаторів, таких як Na₂WO₄ (див., наприклад, R. Noyori, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1999, 72, 2287-2306).

Альтернативний підхід до одержання сполук формули IIb (без використання проміжного кетону формули IV) також описаний на схемі 2. У зазначеному альтернативному підході використовують фталіміди.

Фталіміди формули X, в якій B, R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, можна прямо одержати за реакцією синтезу типу Габриеля, як описано у публікації Mitsunobu (O. Mitsunobu, Synthesis, 1981, 1-28), зі спирту формули VIII і фталіміду за присутності 1-2 екв. трифенілфосфіну і 1-2 екв. діалкілазодикарбоксилату, такого як діетилазодикарбоксилат або діізопропілазодикарбоксилат. Реакцію проводять в інертному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або дихлорметан, при температурі в діапазоні від 0 до 80 °C.

Видалення фталімідної захисної групи, що міститься у сполуках формули X, з одержанням шуканих сполук формули IIb можна провести шляхом гідролізу або за іншими методиками, описаними у літературі, такими як зазначені у публікації Greene, T.W. Protective Groups in Organic Synthesis; J. Wiley & Sons: New York, (1991); Chapter 7.

Фталіміди формули X також можна одержати зі спиртів формули VIII через сполуки формули IX, в якій B, R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, і LG означає групу, що відщеплюється. Типовими групами, що відщеплюються, є хлорид, бромід, йодид, (метилсульфоніл)оксигрупа або [(4-метилфеніл)сульфоніл]оксигрупа. У такій реакції групу, що відщеплюється LG заміняють у присутності акцептора кислоти, яким може бути третинний амін, такий як триетиламін, алкоксид, такий як трет-бутоксид, або карбонат, такий як карбонат калію. Заміщення можна провести в полярних апротонних розчинниках, таких як диметилформамід або диметилсульфоксид, простих ефірних розчинниках, таких як тетрагідрофуран або діоксан, або протонних розчинниках, таких як етанол. Температура проведення реакції звичайно перебуває в діапазоні від 20 до 150 °C.

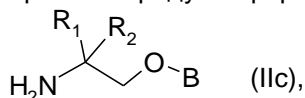
Фталіміди формули X також можна одержати за іншою методологією: захищені фталімідною групою β-аміноспирти формули XI, в якій R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, можна перетворити у фталіміди формули X за реакцією заміщення гідроксигрупи з використанням гідроксипохідних формули VI за реакцією Мицунобу (описана в публікації: Kenyu, J.A., Synlett, 1999, (10), 1615-1617).

Сполуки формули XI можна синтезувати з аміноспирту формули XII, в якій R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, за реакцією із фталевим ангідридом (як описано в публікації: Bose, A.K., J.Org. Chem., 1958, 23, 1335-1338).

Ще однією методологією одержання фталімідів формули X є перетворення сполук формули XI у сполуки формули XIII, в якій R₁, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIb, і LG

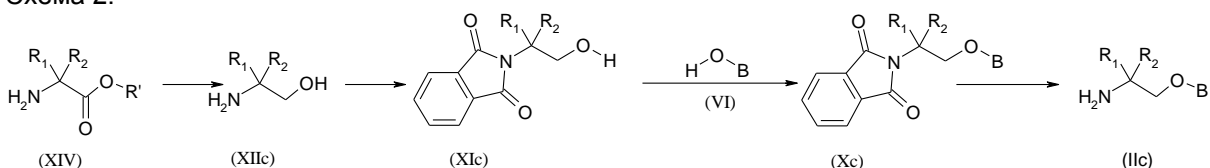
означає групу, що відщеплюється, визначену для формули IX, за стандартними методиками перетворення спиртів у галогеніди (як описано у публікації: March, J. Advanced Organic Chemistry; J. Wiley & Sons: New York, (1992); 4th Ed, pp 498-499). Сполуки формули XIII потім можна перетворити в сполуки формули X за реакціями заміщення, описаними вище для перетворення сполук формули IX у сполуки формули X.

Проміжні продукти формули IIc



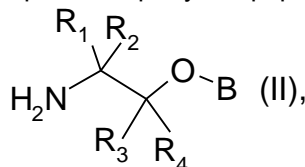
в якій В є таким, як визначено для формули I і R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₁-C₆-алкоксигрупу, C₁-C₆-галогеналкоксигрупу, C₁-C₆-алкілтіогрупу або C₁-C₆-галогеналкілтіогрупу; або R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; можна одержати, як показано на схемі реакцій 2.

Схема 2:



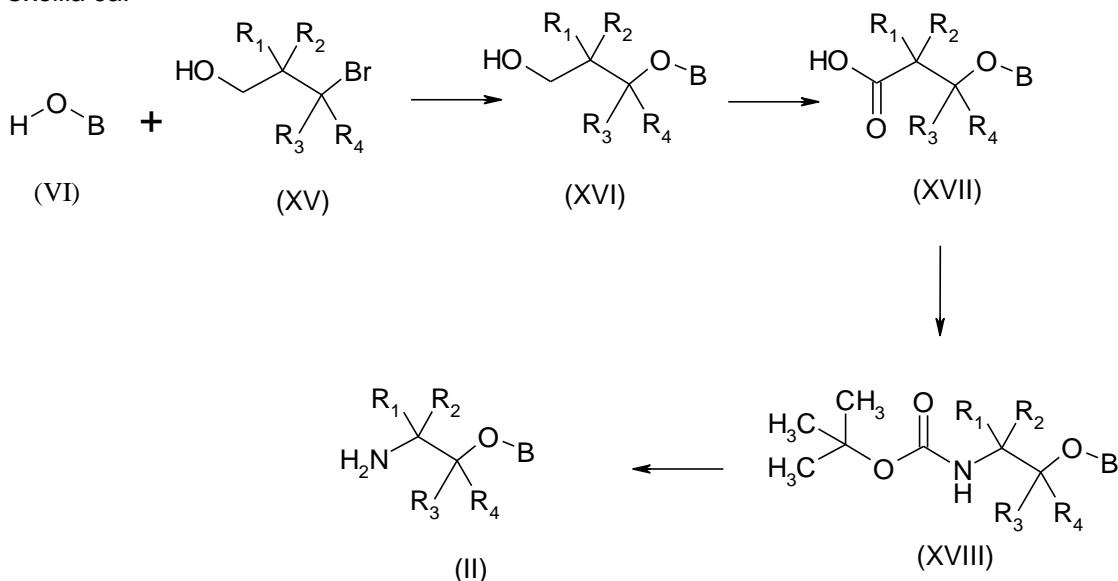
Похідні амінокислот формули XIV, в якій R₁ і R₂ є такими, як визначено для формули IIc, і R' означає C₁-C₆-алкіл, можна відновити в аміноспирти формули XIIc, в якій R₁ і R₂ є такими, як визначено для формули IIc, за відомими методиками відновлення. Аміноспирти формули XIIc можна перетворити в шукані сполуки формули IIc через проміжні фталіміди формул XIc, у яких R₁ і R₂ є такими, як визначено для формули IIc, і Xc, в якій В, R₁ і R₂ є такими, як визначено для формули IIc, шляхом використання гідроксипохідних формули VI і такої ж методології, як представлена на схемі 1.

Проміжні продукти формули II



в якій В, R₁, R₂, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули I, також можна одержати, як показано на схемі реакцій 3а.

Схема 3а:



Проміжні продукти формули XVI, в якій B, R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули II, можна одержати за реакцією Вільямсона гідроксипохідної формули VI, в якій B є таким, як визначено для формули II, з похідною 3-бром-пропан-1-олу формули XV, в якій R₁, R₂, R₃, і R₄ є

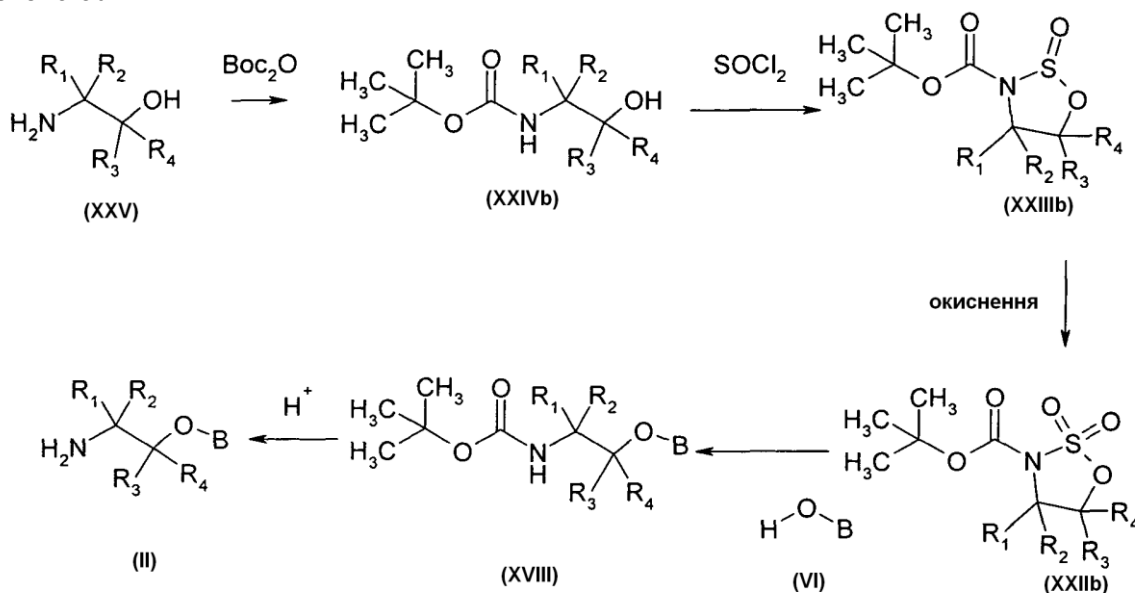
Потім сполуку формули XVI можна окислити, наприклад, шляхом використання RuO₂/NaIO₄ у відповідну похідну пропанової кислоти формули XVII, в якій B, R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули II.

Похідну пропанової кислоти формули XVII потім можна перетворити в захищену групою BOC карбаматну похідну формули XVIII, в якій B, R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули II, за допомогою перегрупування Курциуса його гідразидної похідної, одержаної з використанням дифенілфосфордіазидату і обробки ізоціанатої похідної за допомогою t-Bu-OH (структури гідразидної і ізоціанатної похідних не показані).

Видалення захисної групи BOC зі сполук формули XVIII з одержанням сполук формули II можна провести за присутності сильної кислоти, такої як HCl.

Альтернативно, сполуки формули II (хіральної, якщо R₁ відрізняється від R₂) також можна одержати, як показано на схемі реакцій 3b:

Схема 3b:



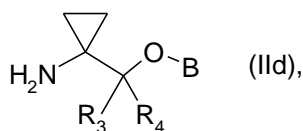
Хіральні сполуки формули XXIVb, в якій R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули Ib і R₁ відрізняється від R₂, можна одержати за реакцією хіального аміноспирту формули XXV, в якій R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули Ib і R₁ відрізняється від R₂, з Boc₂O при стандартних умовах. Циклічні сульфамідити формули XXIIIb, в якій R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули Ib, потім можна одержати зі сполук формули XXIVb з використанням SOCl₂. Цю реакцію циклізації можна провести за присутності основи. Придатною основою є піридин. Придатні розчинники включають дихлорметан і нітрили, такі як ацетонітрил і пропіонітрил. Температура проведення реакції звичайно перебуває в діапазоні від -50 до 20 °C.

Циклічні сульфамідати формули XXIIb, в якій A, R₁, R₂, R₃, і R₄ є такими, як визначено для формули Ib, можна одержати окисненням циклічних сульфамідитів формули XXIIIb. Придатними окисними реагентами є Ru₄ і RuCl_{3,3}H₂O у комбінації з NaIO₄. Придатні розчинники включають суміші нітрлів і води; в якості нітрлу можна використовувати, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил. Температура проведення реакції звичайно перебуває в діапазоні від 0 до 30 °C.

Потім циклічні сульфамідати формули XXIIb можна ввести у реакцію зі сполуками формули VI, в якій B є таким, як визначено для формули Ib, з утворенням сполуки формули XVIII. Це розкриття циклу за допомогою кисеньвміщуючих нуклеофільних реагентів можна провести за присутності основи. Придатні основи включають карбонати, такі як гідроксид літію, карбонат цезію, карбонат калію, або гідриди металів, такі як гідрид натрію і гідрид літію. Придатні розчинники включають N, N-диметилформамід, диметилацетамід і ДМСО. Температура проведення реакції може змінюватися у широких межах, але звичайно вона перебуває у

діапазоні від температури навколишнього середовища до 100 °С.

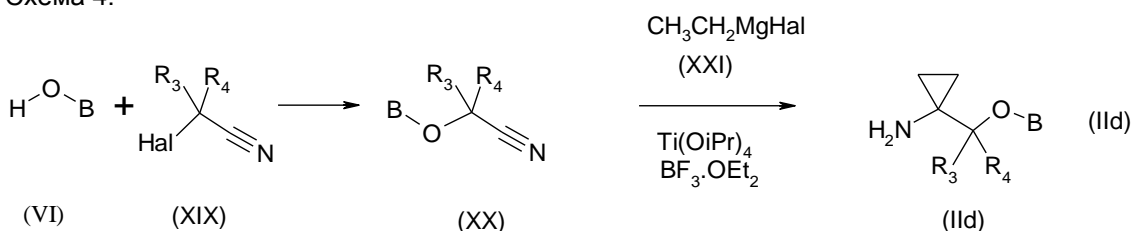
Проміжні продукти формули IIId



(IIId)

в якій В є таким, як визначено для формули I і R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галогеналкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₂-С₆-галогеналкініл, С₁-С₆-алкоксигрупу, С₁-С₆-галогеналкоксигрупу, С₁-С₆-алкілтіогрупу або С₁-С₆-галогеналкілтіогрупу або R₃ і R₄ разом означають С₂-С₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше С₁-С₆-алкільних груп; можна одержати, як показано на схемі реакцій 4.

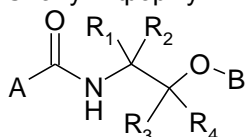
Схема 4:



Нітрили формули XX, в якій В, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIId, можна одержати за реакцією сполуки формули XIX, в якій R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули IIId, і Hal означає галоген, зі сполукою формули VI, в якій В є таким, як визначено для формули IIId, за відомими методиками.

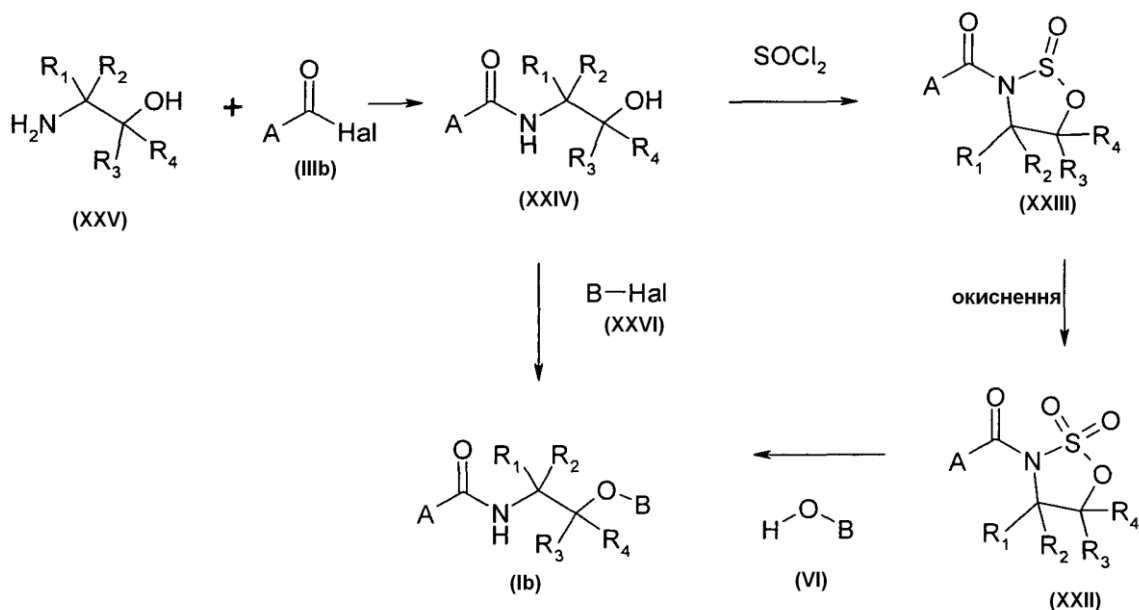
Потім нітрил формули XX можна піддати перетворенню по реакції сполучення, що каталізується, за допомогою Ti-(II) з використанням реагенту Грин'єра формули XXI, в якій Hal означає галоген, і одержати шукані сполуки формули IIId. Умови проведення цієї реакції описані, наприклад, у публікації Р. Bertus and J. Szymoniak (J. Org. Chem., 2002, 67, 3965-3968) і в 1-595-873.

Сполуки формули Ib



в якій А і В є такими, як визначено для формули I і R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галогеналкеніл, С₂-С₆-алкініл або С₂-С₆-галогеналкініл; або R₁ і R₂ разом означають С₂-С₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше С₁-С₆-алкільних груп; або R₁ і R₃ разом означають С₂-С₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше С₁-С₆-алкільних груп; або R₃ і R₄ разом означають С₂-С₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше С₁-С₆-алкільних груп; можна одержати, як показано на схемі реакцій 5.

Схема 5:



Сполуки формули XXIV, в якій A, R_1 , R_2 , R_3 , і R_4 є такими, як визначено для формули Ib, можна одержати за реакцією аміноспирту формули XXV, в якій R_1 , R_2 , R_3 , і R_4 є такими, як визначено для формули Ib, зі сполукою формули III, в якій A є таким, як визначено для формули Ib і Hal означає галоген, бажано хлор, за присутності основи, такої як триетиламін, основа Хьюніга, бікарбонат натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин або хінолін, але бажано триетиламін, і у розчиннику, такому як діетиловий ефір, ТБМЕ (трет-бутилметиловий ефір), ТГФ (тетрагідрофуран), дихлорметан, хлороформ, ДМФ (диметилформамід) або NMP (N-метилпіролідон), протягом від 10 хв до 48 год., бажано від 12 до 24 год. і при температурі от 0 °C до температури кипіння, бажано от 20 до 25 °C.

Циклічні сульфамідити формули XXIII, в якій A, R_1 , R_2 , R_3 , і R_4 є такими, як визначено для формули Ib, потім можна одержати зі сполук формули XXIV шляхом використання SOCl_2 . Цю реакцію циклізації можна провести за присутності основи. Придатною основою є піридин. Придатні розчинники включають дихлорметан і нітрили, такі як ацетонітрil і пропіонітрil. Температура проведення реакції звичайно перебуває в діапазоні від -50 до 20 °C.

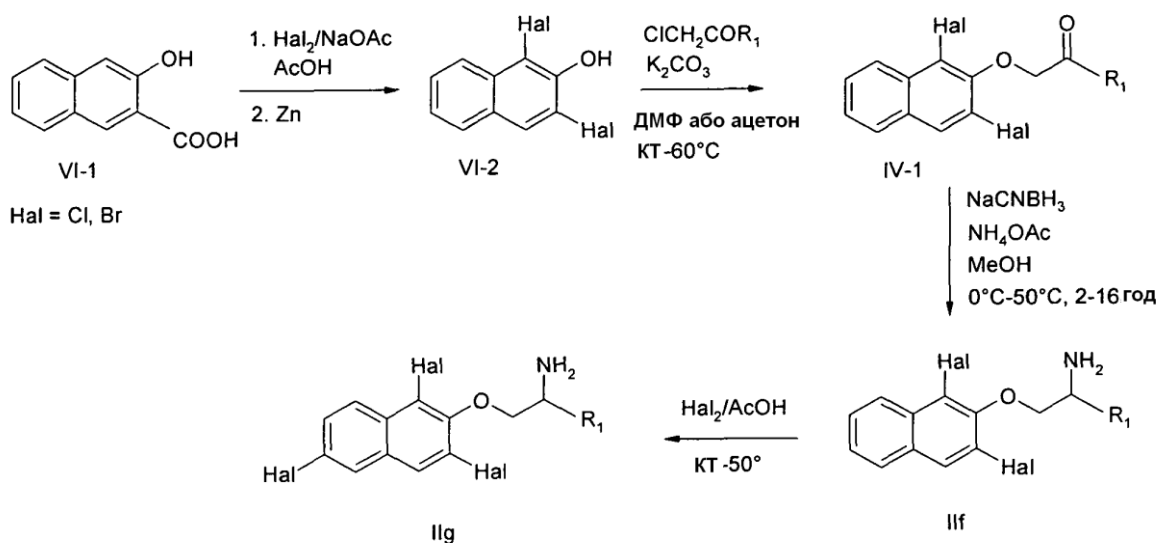
Циклічні сульфамідати формули XXII, в якій A, R_1 , R_2 , R_3 , і R_4 є такими, як визначено для формули Ib, можна одержати окисненням циклічних сульфамідитів формули XXIII. Придатними окисними реагентами є Ru_4 і $\text{RuCl}_{3.3}\text{H}_2\text{O}$ у комбінації з NaIO_4 . Придатні розчинники включають суміші нітрilів і води; як нітрil нітрil можна використовувати, наприклад, ацетонітрil або пропіонітрil. Температура проведення реакції звичайно перебуває в діапазоні від 0 до 30 °C.

Огляд методик одержання циклічних сульфатів і сульфамідатів наведений у публікаціях Lohray, B.B. in *Advances in Heterocyclic Chemistry*; Katritzky, A.R., Ed.; Academic Press: San Diego, 1997; Vol. 68, pp 89-180; і Posakony J. J., *J. Org. Chem.*, 2002, 67, 5164-5169.

Потім циклічні сульфамідати формули XXII можна ввести у реакцію зі сполуками формули VI, в якій B є таким, як визначено для формули Ib, і одержати сполуки формули Ib. Це розкриття циклу за допомогою кисеньвміщуючих нуклеофільних реагентів можна провести за присутності основи. Придатні основи включають карбонати, такі як гідроксид літію, карбонат цезію, карбонат калію, або гідриди металів, такі як гідрид натрію й гідрид літію. Придатні розчинники включають N, N-диметилформамід, диметилацетамід і ДМСО. Температура проведення реакції може змінюватися у широких межах, але звичайно вона перебуває у діапазоні від температури навколишнього середовища до 100 °C.

Альтернативно, сполуки формули Ib можна одержати за реакцією сполук формули XXIV і сполук формули XXVI, в якій B є таким, як визначено для формули Ib і Hal означає галоген. Цю реакцію нуклеофільного заміщення бажано можна використовувати у випадку, коли сполука формули XXVI являє собою активовану галогенароматичну сполуку. У випадку, коли сполука формули XXVI являє собою неактивовану сполуку, зазначену реакцію можна провести при каталізі паладієм або міддю.

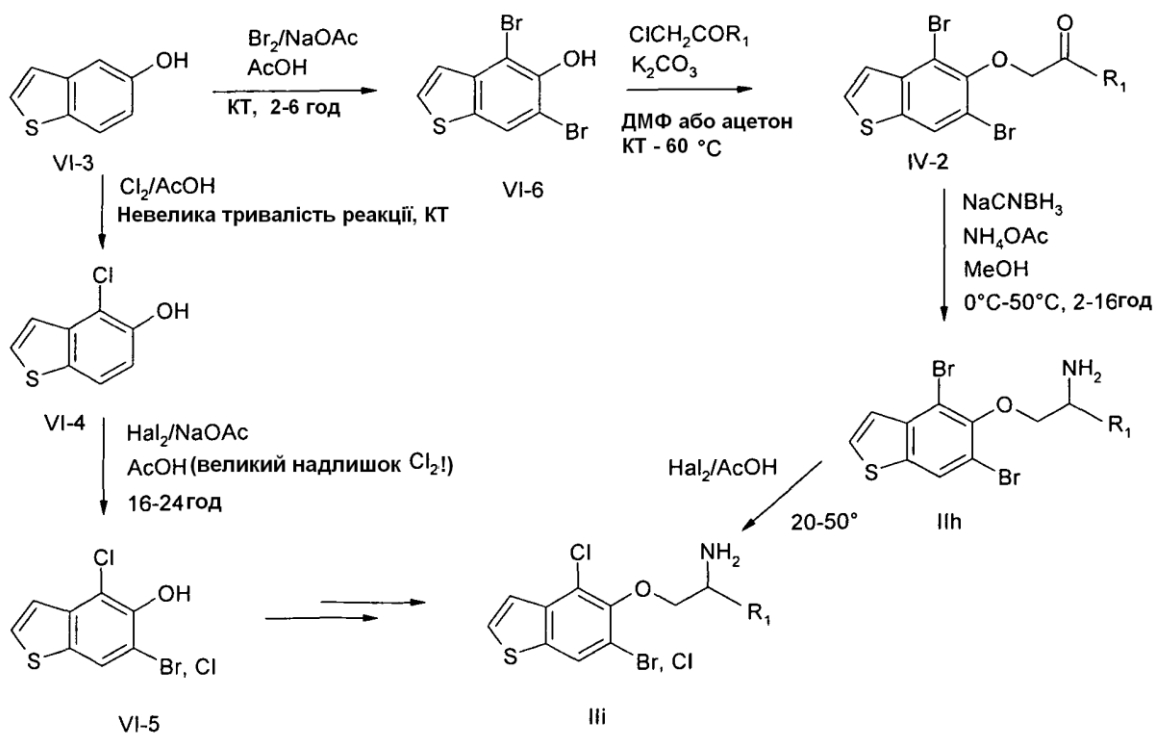
Схема 6: Синтез проміжних нафтолів, у яких R_3 і R_4 означають водень:



Синтез 1,3-заміщених нафтолів описаний у публікації Annalen 1930, 484, 245-300

5

Схема 7: Синтез проміжних 5-гідроксибензо[*b*]тіофенів, в яких R_3 і R_4 означають водень:



10 Синтез 5-гідроксибензо[*b*]тіофену описаний у публікації: Synthetic Communications, 1991, 21, 959-964.

Сполуки формул V, VI, VII, XII, XIV, XV, XIX, XXV і XXVI, у яких замісники є такими, як описано вище, є відомими і наявні у продажу або їх можна одержати відповідно до цитованої вище літератури або за методиками, відомими у даній області техніки.

15 Сполуки формули III і IIIb, у яких замісники є такими, як описано вище, є відомими і деякі з них наявні у продажу. Їх можна одержати аналогічно тому, як описано, наприклад, у WO 00/09482, WO 02/38542, WO 04/018438, 0-589-301, WO 93/11117 і Arch. Pharm. Res. 2000, 23(4), 315-323.

Для одержання всіх інших сполук формули I, що містять функціональні групи відповідно до

визначень A, B, R₁, R₂, R₃ і R₄ існує велика кількість відомих придатних методик, таких як алкілювання, галогенування, ацилювання, амідування, оксимування, окиснення і відновлення. Вибір методик одержання, які є придатними, залежить від властивостей (реакційної здатності) замісників, що містяться у проміжних продуктах.

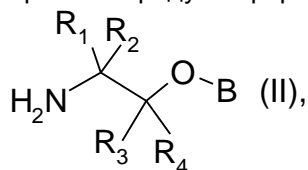
5 Реакції, що приводять до сполук формули I бажано проводять в апротонних інертних органічних розчинниках. Такими розчинниками є вуглеводні, такі як бензол, толуол, ксилол або циклогексан, хлоровані вуглеводні, такі як дихлорметан, трихлорметан, тетрахлорметан або хлорбензол, прості ефіри, такі як діетиловий ефір, диметиловий ефір етиленгліколю, диметиловий ефір діетиленгліколю, тетрагідрофуран або діоксан, нітрили, такі як ацетонітрил або пропіонітрил, амід, такі як N, N-диметилформамід, діетилформамід або N-метилпіролідон. Температура проведення реакції бажано становить від -20 до +120 °С. Звичайно реакції є трохи екзотермічними і як правило їх можна проводити при температурі навколишнього середовища. Для скорочення тривалості проведення реакції або для ініціювання реакції суміш можна короткочасно нагріти до температури кипіння реакційної суміші. Тривалості проведення реакції також можна скоротити шляхом додавання декількох крапель основи, в якості каталізатора реакції. Придатними основами є, зокрема, третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, хінуклідин, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан, 1,5-діазабіцикло[4.3.0]нон-5-ен або 1,5-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен. Однак в якості основи можна використовувати неорганічні основи, такі як гідриди, наприклад, гідрид натрію або гідрид кальцію, гідроксиди, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, такі як карбонат натрію і карбонат калію, або гідрокарбонати, такі як гідрокарбонат калію і гідрокарбонат натрію. Основи можна використовувати самі по собі або з додаванням каталітичних кількостей міжфазового каталізатора, наприклад краун-ефіру, зокрема краун-6, або солі тетраалкіламонію.

25 Сполуки формули I можна виділити звичайним чином шляхом концентрування і/або шляхом випарювання розчинника і очистити за допомогою перекристалізації або розтирання твердого залишку з розчинниками, у яких вони погано розчинні, такими як прості ефіри, ароматичні вуглеводні або хлоровані вуглеводні.

Сполуки формули I і, якщо це доцільно, їх таутомери можуть міститися у формі одного з ізомерів, який є можливим, або у вигляді їх суміші, наприклад, у вигляді чистих ізомерів, таких як антиподи і/або діастереоізомери, або у вигляді сумішей ізомерів, таких як суміші структурних ізомерів, стереоізомерів, діастереоізомерів і енантіомерів, наприклад, рацемати, суміші діастереоізомерів або суміші рацематів залежно від кількості, абсолютної або відносної конфігурації асиметричних атомів вуглецю, які містяться у молекулі, і/або залежно від конфігурації неароматичних подвійних зв'язків, які містяться у молекулі; даний винахід стосується чистих ізомерів, а також всіх сумішей ізомерів, які є можливими і у кожному випадку вище і нижче в даному винаході їх варто розуміти в такому змісті навіть якщо у кожному випадку не зазначені подробиці стереохімії.

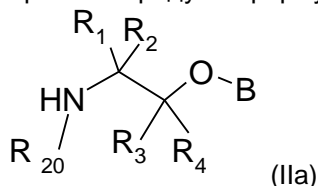
Сполуки I і, якщо це доцільно, їх таутомери, також можна, якщо це доцільно одержати у формі гідратів і/або у формі, що включає інші розчинники, наприклад, ті, які могли використовуватися для кристалізації сполук, які перебувають у твердій формі.

Проміжні продукти формули II



45 в якій B, R₁, R₂, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули I, є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули II також є частиною об'єкта даного винаходу.

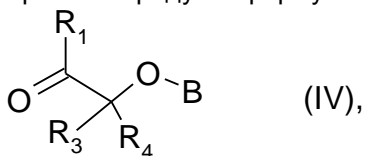
Проміжні продукти формули IIa



50 в якій B, R₁, R₂, R₃ і R₄ є такими, як визначено для формули I, і R₂₀ означає C₃-C₇-циклоалкіл бажано - циклопропіл, є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули IIa також є частиною об'єкта даного

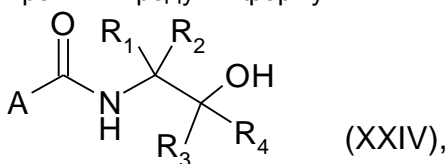
винаходу.

Проміжні продукти формули IV



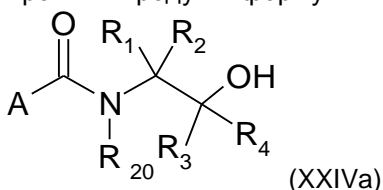
в якій В є таким, як визначено для формули I і R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галогеналкініл, C₁-C₆-алкоксигрупу, C₁-C₆-галогеналкоксигрупу, C₁-C₆-алкілтіогрупу або C₁-C₆-галогеналкілтіогрупу; або R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; або R₃ і R₄ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули IV також є частиною об'єкта даного винаходу.

Проміжні продукти формули XXIV



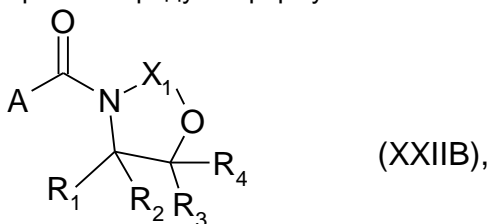
в якій А є таким, як визначено для формули I і R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл або C₂-C₆-галогеналкініл; або R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; або R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; або R₃ і R₄ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули XXIV також є частиною об'єкта даного винаходу.

Проміжні продукти формули XXIVa



в якій А є таким, як визначено для формули I, R₂₀ означає C₃-C₇-циклоалкіл, бажано - циклопропіл, і R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл або C₂-C₆-галогеналкініл; або R₁ і R₂ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; або R₁ і R₃ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; або R₃ і R₄ разом означають C₂-C₅-алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C₁-C₆-алкільних груп; є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули XXIV також є частиною об'єкта даного винаходу.

Проміжні продукти формули XXIIb



в якій А є таким, як визначено для формули I; X₁ означає -S(O)- або -S(O)₂-; і R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного означають водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₂-C₆-алкініл або C₂-C₆-галогеналкініл; або R₁ і

R_2 разом означають C_2 - C_5 -алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C_1 - C_6 -алкільних груп; або R_1 і R_3 разом означають C_2 - C_5 -алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C_1 - C_6 -алкільних груп; або R_3 і R_4 разом означають C_2 - C_5 -алкіленову групу, яка є незаміщеною або заміщеною однією або більше C_1 - C_6 -алкільних груп; є новими і розроблені спеціально для одержання сполук формули I. Відповідно до цього, такі проміжні продукти формули XXIIВ також є частиною об'єкта даного винаходу.

Згідно винаходу було встановлено, що сполуки формули I, пропоновані у даному винаході, з практичної точки зору мають дуже привабливий спектр активності для захисту корисних рослин від хвороб, які викликаються фітопатогенними мікроорганізмами, такими як гриби, бактерії або віруси.

Даний винахід стосується способу боротьби із зараженням корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами або його попередження, у якому сполуки формули I наносять в якості активного інгредієнта на рослини, на їх частини або місце їх зростання. Сполуки формули I, пропоновані у даному винаході, відрізняються чудовою активністю при низьких нормах витрати, добре переносяться рослинами і вони є екологічно безпечними. Вони мають дуже корисні лікувальні, попереджувальні і системні характеристиками і застосовуються для захисту численних культурних рослин. Сполуки формули I можна використовувати для придушення або знищення шкідників, що знаходяться на рослинах або частинах рослин (плодах, квітках, листках, стеблах, бульбах, коріння) різних культур корисних рослин і одночасно для захисту також і тих частин рослин, які виростають пізніше, наприклад, від фітопатогенних мікроорганізмів.

Сполуки формули I також можна використовувати в якості протравлювальних агентів для матеріалу для розмноження рослин, наприклад, насіння (плоди, бульби, зерна) і саджанців рослин (наприклад, рису), для захисту від грибкових інфекцій, а також фітопатогенних грибів, що зустрічаються у ґрунті.

Крім того, сполуки формули I, пропоновані у даному винаході, можна використовувати для боротьби з грибами у суміжних галузях, наприклад, для захисту технічних матеріалів, включаючи деревину і виготовлені з використанням деревини технічні продукти, при зберіганні харчових продуктів, при гігієнічних заходах.

Сполуки формули I наприклад, ефективні проти фітопатогенних грибів наступних класів: Fungi imperfecti (наприклад, Botrytis, Pyricularia, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora і Alternaria) і базидіоміцети (наприклад, Rhizoctonia, Hemileia, Puccinia). Крім того, вони також ефективні проти класів аскоміцетів (наприклад, Venturia і Erysiphe, Podosphaera, Monilinia, Uncinula) і класів ооміцетів (наприклад, Phytophthora, Pythium, Plasmopara). Виявлено надзвичайно високу активність щодо справжньої борошнистої роси (Erysiphe spp.). Крім того, нові сполуки формули I ефективні проти фітопатогенних бактерій і вірусів (наприклад, проти Xanthomonas spp, Pseudomonas spp, Erwinia amylovora, а також проти вірусу тютюнової мозаїки). Виявлена хороша активність щодо азійської соєвої іржі (Phakopsora pachyrhizi).

В обсязі даного винаходу корисні рослини, що підлягають захисту, зазвичай включають наступні види рослин: злаки (пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, кукурудза, сорго і споріднені види); буряк (цукровий буряк та кормовий буряк); яблука, кісточкові та ягоди (яблука, груші, сливи, персики, мигдаль, вишні, суниця, малина і чорна смородина); бобові рослини (боби, сочевиця, горох, соя); олійні рослини (ріпак, гірчиця, мак, оливи, соняшник, кокос, рицина, какао-боби, земляний горіх); огіркові рослини (гарбузи, огірки, дині); волокнисті рослини (бавовна, льон, коноплі, джут); цитрусові фрукти (апельсини, лимони, грейпфрути, мандарини); овочі (шпинат, латук, спаржа, капуста, морква, луки, томати, картопля, червоний перець); лаврові (авокадо, кориця, камфора) і такі рослини, як тютюн, горіхи, кава, баклажани, цукровий очерет, чай, перець, виноград, хміль, банани і натуральні каучуконосні рослини, а також декоративні рослини.

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає і корисні рослини, яким надана стійкість до гербіцидів, таким як бромоксиніл, або до або класів гербіцидів (таким як, наприклад, інгібітори ГФПД (4-гідроксифенілпіруватдіоксигеназа), інгібітори АЛС (ацетолактатсинтаза), наприклад, примісульфурон, просульфурон і трифлорсульфурон, інгібітори ЕПШФС (5-енолпіровілішкімат-3-фосфатсинтаза), інгібітори ГС (глутамінсинтетаза) або інгібітори ППО (протопорфіриногеноксидаза)) за допомогою звичайних методик селекції або генної інженерії. Прикладом культури, якій за допомогою звичайних методик селекції (мутагенезу) надана стійкість, наприклад, до імідазолінонам, наприклад, імазамоксу, є суріпиця Clearfield® (канола). Прикладами культур, яким за допомогою методик генної інженерії надана стійкість до гербіцидів або класів гербіцидів, є сорти кукурудзи, стійкі, наприклад, до гліфозату або глюфозінату, які є у продажу під торговими назвами RoundupReady®, Herculex I® і LibertyLink®.

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає і корисні рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантних ДНК змінені таким чином, що вони здатні синтезувати один або більшу кількість токсинів, що надають селективну дію, таких як, для яких відомо, наприклад, що вони виробляються бактеріями, що продукують токсини, особливо роду *Bacillus*.

Термін "корисні рослини" слід розуміти, як такий, що включає і корисні рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантних ДНК змінені таким чином, що вони здатні синтезувати протипатогенні речовини, що справляють селективний вплив, таких як, наприклад, так звані "пов'язані з патогенезом білки" (PRP, див., наприклад, EP-A-0392225). Приклади таких протипатогенних речовин і трансгенних рослин, здатних синтезувати такі проти патогенні речовини, наведені, наприклад, у EP-A-0392225, WO 95/33818, EP-A-0353191. Методики одержання таких трансгенних рослин зазвичай відомі спеціалісту у даній області техніки і описані, наприклад, у вказаних вище публікаціях.

Термін "місце зростання" корисної рослини при використанні у даному винаході означає місце, на якому виростають корисні рослини, на якому висіяні матеріали для розмноження корисних рослин або на якому будуть поміщені у ґрунт матеріали для розмноження корисних рослин. Прикладом такого місця зростання є поле, на якому виростають культурні рослини.

Термін "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти, як такий, що означає всі генеративні частини рослини, такі як насіння, які можна застосовувати для розмноження останніх, і вегетативний матеріал, такий як черешки і бульби, наприклад, картоплю. Наприклад, можна відзначити насіння (у прямому сенсі слова), коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища, частини рослин. Також можна відзначити пророслі рослини чи розсаду, які необхідно пересадити після проростання або появи сходів з ґрунту. Цю розсаду можна захистити до пересадки шляхом повної або часткової обробки, що проводиться шляхом занурення. Слід розуміти, що бажаний "матеріал для розмноження рослин" означає насіння.

Сполуки формули I застосовуються в незміненому вигляді або, бажано, спільно з носіями і допоміжними речовинами, які зазвичай застосовуються для приготування препаратів.

Тому даний винахід також стосується композицій для боротьби з фітопатогенними мікроорганізмами та захисту від них, що включає сполуку формули I і інертний носій, і способу боротьби із зараженням корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами та його попередження, в якому композицію, що включає сполуку формули I в якості активного інгредієнта і інертний носій, наносять на рослини, на їх частини або на місце їх зростання.

Для цього сполуки формули I і інертні носії зазвичай готують відомим чином у вигляді емульгувальних концентратів, паст для нанесення, розчинів, що безпосередньо розпилюються або розбавляються, розведених емульсій, змочувальних порошків, розчинних порошків, дустів, гранулятів, а також форм, капсульованих, наприклад, у полімерних речовинах. Як і тип композиції, методики внесення, такі як обприскування, атомізація, запилення, розкидання, нанесення шару або полив, вибираються відповідно до призначення і існуючої ситуації. Композиції також можуть містити інші допоміжні речовини, такі як стабілізатори, протипінні речовини, регулятори в'язкості, сполучні речовини, речовини, що додають клейкість, а також добрива, джерела поживних мікроелементів або інші композиції, призначені для забезпечення спеціальних ефектів.

Сполуки формули I або композиції, що містять сполуки формули I в якості активного інгредієнта, і інертний носій, можна наносити на місце вирощування або рослину, що обробляється, одночасно або послідовно з додатковими сполуками. Цими додатковими сполуками можуть бути, наприклад, добрива або джерела мікроелементів або інші препарати, які впливають на ріст рослин. Ними також можуть бути селективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематоциди, молюскоциди або суміші кількох з цих препаратів, при необхідності разом з додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами або допоміжними речовинами, що поліпшують нанесення, які зазвичай застосовуються в області приготування препаратів.

Бажаним способом внесення сполуки формули I або композиції, що включає сполуку формули I в якості активного інгредієнта і інертний носій, є некореневе внесення. Частота внесення та норма витрати залежать від небезпеки зараження відповідним патогеном. Однак сполуки формули I також можуть проникати у рослину через корені з ґрунту (системний вплив) при дощуванні місця зростання рослин рідким препаратом або при внесенні сполук у ґрунт у твердому вигляді, наприклад, у гранульованому вигляді (ґрунтове внесення). Під затоплювані культури, такі як рис, такі грануляти можна вносити на залите рисове поле. Сполуки формули I також можна наносити на насіння (у вигляді покриття) шляхом просочування насіння або бульб рідким препаратом фунгіциду або нанесення на них покриття з твердого препарату.

Препарат, тобто композицію, яка містить сполуку формули I і при необхідності тверду або рідку допоміжну речовину, готують за відомими методиками, звичайно шляхом ретельного змішування і/або розмелювання сполуки з наповнювачами, наприклад, розчинниками, твердими носіями і необов'язково поверхнево-активними речовинами.

5 Агрохімічні препарати зазвичай містять від 0,1 до 99 мас. %, бажано - від 0,1 до 95 мас. % сполуки формули I, від 99,9 до 1 мас. %, бажано - від 99,8 до 5 мас. % твердої або рідкої допоміжної речовини і від 0 до 25 мас. %, бажано - від 0,1 до 25 мас. % поверхнево-активної речовини.

10 У той час як комерційні продукти бажано готувати у вигляді концентратів, кінцевий користувач зазвичай буде використовувати розбавлені препарати.

Бажані норми витрати зазвичай складають від 5 г до 2 кг активного інгредієнта (AI) на гектар (га), бажано - від 10 г до 1 кг AI/га, найбільш бажано - від 20 г до 600 г AI/га. При використанні в якості засобу для замочування насіння звичайні дози становлять від 10 мг до 1 г активної речовини на 1 кг насіння. Норму витрат для забезпечення необхідного впливу можна визначити експериментально. Вона залежить, наприклад, від типу впливу, стадії розвитку корисної

рослини і від нанесення (ділянки, тимчасового режиму, методики внесення) і в залежності від цих параметрів змінюється у широких межах.

20 Згідно винаходу несподівано було встановлено, що сполуки формули I також можна використовувати у способах захисту культур корисних рослин від нашествия фітопатогенних мікроорганізмів, а також для лікування культур корисних рослин, заражених фітопатогенними мікроорганізмами, що включають нанесення комбінації гліфосату і принаймні однієї сполуки формули I на рослину або місце його зростання, в якому рослина стійка або чутлива до гліфосату.

25 Зазначені способи можуть забезпечити несподіване покращення боротьби з хворобами у порівнянні з використанням сполук формули I при відсутності гліфосату. Зазначені способи можуть бути ефективними для поліпшення боротьби з хворобами за допомогою сполук формули I. Хоча суміш гліфосату і принаймні однієї сполуки формули I може принаймні частково розширити спектр хвороб, з якими проводиться боротьба за допомогою сполук формули I, також може спостерігатися підвищення активності впливу сполук формули I при

30 впливі на хвороби, для яких вже відомо, що вони певною мірою придушуються сполукою формули I. Зазначені способи є особливо ефективними для боротьби з фітопатогенними мікроорганізмами царства гриби, типу базидіоміцети, класу Uredinomyces, підкласу Urediniomycetidae і ряду Uredinales (зазвичай називаються іржі). Види іржі, особливо сильно впливають на сільськогосподарські культури, включають види сімейства Phakopsoraceae, особливо види роду Phakopsora, наприклад, Phakopsora pachyrhizi, яка також називається азійською соєвою іржею, і види сімейства Pucciniaceae, особливо види роду genus Puccinia, такі як Puccinia graminis, також відома, як стеблова іржа або чорна іржа, яка є небезпечною

40 хворобою злаків, і Puccinia recondita, також відома, як бура іржа. Один варіант здійснення даного винаходу належить до способу захисту культур корисних рослин від нашествия фітопатогенних мікроорганізмів та/або лікування культур корисних рослин, заражених фітопатогенними мікроорганізмами, зазначений спосіб включає одночасне нанесення гліфосату, включаючи його солі або складні ефіри, і принаймні однієї сполуки формули I, яка має активність щодо фітопатогенних мікроорганізмів, принаймні на один об'єкт,

45 вибраний з групи, що включає рослину, частину рослини і місце її зростання. Сполуки формули I або їх фармацевтичні солі, описані вище, також мають спектр активності, придатним для усунення та/або попередження мікробної інфекції у тварини.

"Твариною" може бути будь-яка тварина, наприклад, комаха, ссавець, рептилія, риба, амфібія, бажано - ссавець, найбажаніше - людина. "Лікування" означає застосування до тварини, у якій є мікробна інфекція, для зменшення, або ослаблення, або зупинки підсилення або розповсюдження інфекції, або для послаблення інфекції, або для усунення інфекції. "Попередження" означає застосування до тварини, у якій відсутні видимі ознаки мікробної інфекції, для попередження будь-якої майбутньої інфекції, або для зменшення, або послаблення підсилення або розповсюдження будь-якої майбутньої інфекції.

55 Даний винахід стосується застосування сполуки формули I для приготування лікарського засобу, призначеного для усунення та/або попередження мікробної інфекції у тварини. Даний винахід також стосується застосування сполуки формули I в якості лікарського засобу. Даний винахід також стосується застосування сполуки формули I в якості протимікробного засобу для лікування тварини. Даний винахід також стосується фармацевтичної композиції, що включає в якості активного інгредієнта сполуку формули I або її фармацевтично прийнятну сіль і

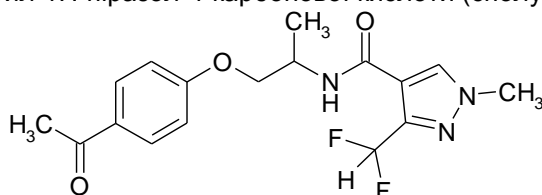
фармацевтично прийнятний носій або розріджувач. Цю композицію можна застосовувати для усунення та/або попередження мікробної інфекції у тварини. Ця фармацевтична композиція може перебувати у формі, що підходить для перорального введення, такий як таблетка, коржики, тверді капсули, водні суспензії, масляні суспензії, емульсії, диспергувальні порошки, диспергувальні гранули, сиропи і еліксири. Альтернативно, ця фармацевтична композиція може перебувати у формі, що підходить для місцевого нанесення, такий як спрей, крем або лосьйон. Альтернативно, ця фармацевтична композиція може перебувати у формі, що підходить для парентерального введення, наприклад, ін'єкції. Альтернативно, ця фармацевтична композиція може знаходитися в інгаляційній формі, такий як розпилювальний аерозоль.

Сполуки формули I ефективні для боротьби з мікроорганізмами різних видів, які можуть призвести до мікробної інфекції у тварини. Прикладами таких видів мікроорганізмів є ті, які викликають аспергіллез, такі як *Aspergillus fumigatus*, *A. flavus*, *A. terreus*, *A. nidulans* і *A. niger*; які викликають бластомікоз, такі як *Blastomyces dermatitidis*; які викликають кандидоз, такі як *Candida albicans*, *C. glabrata*, *C. tropicalis*, *C. parapsilosis*, *C. krusei* і *C. lusitanae*; які викликають кокцидіодомікоз, такі як *Coccidioides immitis*; які викликають криптококоз, такі як *Cryptococcus neoformans*; які викликають гістоплазмоз, такі як *Histoplasma capsulatum* і які викликають зиготомікоз, такі як *Absidia corymbifera*, *Rhizomucor pusillus* і *Rhizopus arrhizus*. Іншими прикладами є *Fusarium* Spp, такі як *Fusarium oxysporum* і *Fusarium solani* і *Scedosporium* Spp, такі як *Scedosporium apiospermum* і *Scedosporium prolificans*. Додатковими прикладами є *Microsporum* Spp, *Trichophyton* Spp, *Epidermophyton* Spp, *Mucor* Spp, *Sporothrix* Spp, *Phialophora* Spp, *Cladosporium* Spp, *Petriellidium* spp, *Paracoccidioides* Spp і *Histoplasma* Spp.

Наведені нижче необмежуючі приклади більш докладно ілюструють даний винахід, що описаний вище, не накладаючи на нього обмеження.

Приклади одержання:

Приклад P1: Одержання [2-(4-ацетил-п-фенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.098):

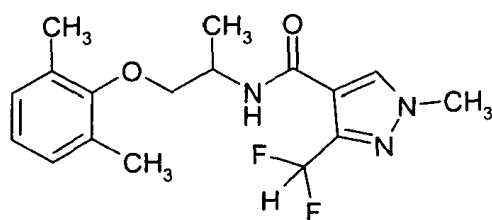


До розчину 4-гідроксиацетофенону (0,14 г; 1 ммоль) у диметилформаміді (4 мл) порціями додають гідрид натрію 50 % у маслі (0,04 г; 1 ммоль). Реакційну суміш перемішують протягом 15 хв при температурі навколишнього середовища і потім додають 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-4-метил-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону (0,33 г; 1,1 ммоль), який одержують, як описано в прикладі P5с, у диметилформаміді (0,5 мл). Реакційну суміш перемішують протягом 1 год. при температурі навколишнього середовища, потім виливають у 1М НСІ (40 мл) і екстрагують етилацетатом (2×30 мл). Об'єднані етилацетатні шари промивають водою (20 мл) і потім сушать над Na₂SO₄. Після видалення розчинника залишок очищають за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (елюент: циклогексан/етилацетат 7:3). 0,16 г (46 % від теоретичного значення) [2-(4-ацетил-п-фенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.098) одержують у вигляді смоли.

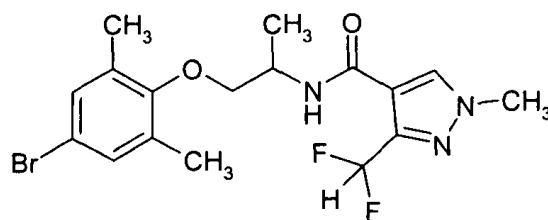
¹Н ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,40(d, 3H, CH₃), 2,53(s, 3H, CH₃), 3,90(s, 3H, CH₃), 4,05-4,12(m, 2H, CH₂), 4,52-4,57(m, 1H, CH), 6,68(m_{широкий}, 1H, NH), 6,71-6,98(t, 1H, CHF₂), 6,94-6,97(d, 2H, Ar-H), 7,90-7,94(m, 3H, 2H-Ar+1H, піразол-Н).

МС [M+H]⁺ 352.

Приклад P2: Одержання [2-(2,6-диметилфенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.166) і [2-(4-бром-2,6-диметилфенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.168):



сполука 1.166



сполука 1.168

При 0 °С розчин 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду (0,29 г; 1,5 ммоль) у дихлорметані (3 мл) при перемішуванні по краплям додають до розчину 0,35 г (1,5 ммоль) суміші складу 4:1 2-(4-бром-2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.168) і 2-(2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.166), які одержують, як описано у прикладі Р6, і триетиламіну (0,3 г; 3 ммоль) у дихлорметані (20 мл). Реакційну суміш перемішують протягом 1 год. при температурі навколишнього середовища і потім витримують протягом 2 год. Реакційну суміш промивають за допомогою 1М NaOH (10 мл) і 1М HCl (10 мл) і потім сушать над Na₂SO₄. Після видалення розчинника залишається 0,65 г залишку. Обидва продукти реакції виділяють за допомогою колонкової хроматографії (колонка Waters, RP PrepC18, 10 мкм, 50 мм×250 мм; розчинники: А = ацетонітрил, В = вода; градієнтний режим: від 50 % до 0 % В протягом 15 хв; швидкість потоку: 2,0 мл/хв):

а) 90 мг (18 % від теоретичного значення) [2-(2,6-диметилфенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.166) одержують у вигляді твердої речовини (т. пл. 142-146 °С). Час утримання для цієї сполуки дорівнює 10,78 хв.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,46-1,48(d, 3H), 2,21(2s, 6H), 3,77-3,87(ddd, 2H), 3,94(s, 3H), 4,47-4,53(m, 1H), 6,76-7,03(t, 1H), 6,79(s, 1H), 6,91(d, 1H), 7,00(d, 2H), 7,93(s, 1H).

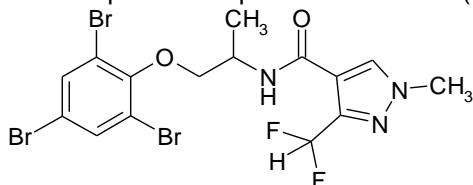
МС [M+H]⁺ 338.

б) 390 мг (63 % від теоретичного значення) [2-(4-бром-2,6-диметилфенокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.168) одержують у вигляді твердої речовини (т. пл. 119-121 °С). Час утримання для цієї сполуки дорівнює 12,53 хв.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,44-1,46(d, 3H), 2,21(2s, 6H), 3,72-3,85(ddd, 2H), 3,89(s, 3H), 4,46-4,51(m, 1H), 6,76(s, 1H), 6,77-7,03(t, 1H), 7,11(s, 1H), 7,93(s, 1H).

МС [M+H]⁺ 416/418.

Приклад Р3: Одержання [1-метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)етил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.193):

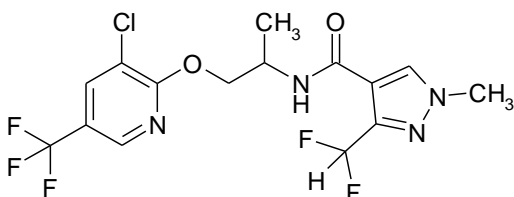


Суміш 0,3 г (0,8 ммоль) 1-метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)етиламіну (сполука Z1.193, одержана, як описано у прикладі Р7) і 0,15 г (0,9 ммоль) 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти у 2 мл піридину в атмосфері азоту охолоджують до 0 °С. По краплям додають оксихлорид фосфору (0,08 мл, 0,9 ммоль) і Реакційну суміш перемішують при 80 °С протягом 12 год. Реакційну суміш розбавляють водою і 3 рази екстрагують етилацетатом. Об'єднані етилацетатні шари промивають за допомогою 1,5 н. HCl, насиченим розчином NaHCO₃, водою і розсолем, сушать над сульфатом натрію і випарюють досуха. Залишок очищають за допомогою колонкової хроматографії (з використанням 60-120 меш силікагелю у гексані; елюент: етилацетат) і одержують 0,12 г [1-метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)-етил]-аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (27 % від теоретичного значення) у вигляді жовтої твердої речовини.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,48-1,50 (d, 3H), 3,93 (s, 3H, NCH₃), 4,02-4,12 (ddd, 2H, CH₂), 4,50-4,55 (m, 1H), 6,67 (s, 1H, NH), 6,78-7,05 (t, 1H, CHF₂), 7,65 (s, 1H), 7,88 (s, 1H, піразол-Н),

РХМС {режим іонізації електророзпиленням з утворенням позитивних іонів}: 543,8 / 545,77 / 549,81

Приклад Р4: Одержання [2-(3-хлор-5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-1-метилетил]аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.239):



Розчин 2,3 г (2-гідрокси-1-метилетил) аміда 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (10,0 ммоль, одержаний, як описано у прикладі Р5а) і 2,6 г 2-бром-3-хлор-5-трифторметилпіридину (10 ммоль) у диметилформаміді (30 мл) при температурі навколишнього середовища обробляють за допомогою 2,8 г карбоната калію (20 ммоль). Одержану суспензію перемішують при 100 °С протягом 3 год., охолоджують до температури навколишнього середовища, виливають у воду (200 мл) і екстрагують етилацетатом (2×100 мл). Об'єднані етилацетатні шари промивають водою (20 мл) і сушать над Na₂SO₄. Після видалення розчинника залишок (4,2 г у вигляді масла) очищають за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (елюент: циклогексан/етилацетат 3:7). 1,4 г (34 % від теоретичного значення) [2-(3-хлор-5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-1-метилетил]-аміду 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (сполука 1.239) одержують у вигляді твердої речовини (т. пл. 115-118 °С).

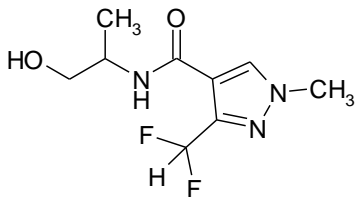
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,39-1,41(d, 3H, CH₃), 3,91(s, 3H, CH₃), 4,46-4,54

(m, 2H, CH₂), 4,60-4,66(m, 1H, CH), 6,63(s, 1H, NH), 6,67-6,81(t, 1H, CHF₂), 7,85(d, 1H, Py-H), 7,90(s, 1H, піразол-H), 8,30(t, 1H, Py-H).

МС [M+H]⁺ 413/415.

Приклад Р5: Одержання 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл)-4-метил-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону

а) Одержання (2-гідрокси-1-метилетил)аміда 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти:

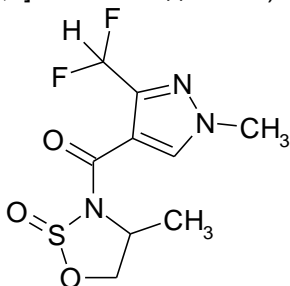


При 0 °С розчин 38,9 г 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонілхлориду (0,2 моля) у 100 мл дихлорметану при перемішуванні по краплям додають до розчину 15 г аланінолу (0,2 моля) і 25 г триетиламіну (0,25 моля) у 400 мл дихлорметану. Реакційну суміш перемішують протягом 1 год. при температурі навколишнього середовища і потім витримують протягом 3 год. при температурі навколишнього середовища. Після видалення розчинника залишок очищають за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі 400 г (елюент: етилацетат/метанол 19:1). 42 г (90 % від теоретичного значення) (2-гідрокси-1-метилетил)аміда 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти одержують у вигляді твердої речовини (т. пл. 81-87 °С).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,23-1,26(d, 3H), 2,97(s, 1H, OH), 3,57-3,73(ddd, 2H), 3,94(s, 3H), 4,17-4,23(m, 1H), 6,57(s, 1H), 6,75-7,02(t, 1H), 7,90(s, 1H).

МС [M+H]⁺ 234.

б) Одержання 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл)-4-метил-2-оксо-2-λ⁴-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону:

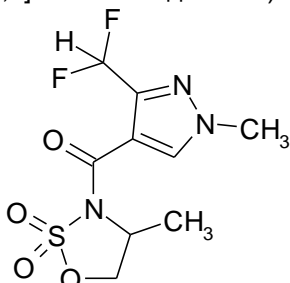


Розчин 14,6 мл SOCl₂ (200 ммоль) у 98 мл сухого ацетонітрилу в атмосфері азоту охолоджують до -40 °С і по краплям додають 18,6 г (2-гідрокси-1-метилетил)аміда 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (80 ммоль) в 70 мл ацетонітрил. Повільно додають 32,2 мл сухого піридину. Потім суміші дають нагрітися до температури навколишнього середовища і перемішують протягом 1,5 год. Об'єм розчинника зменшують до

100 мл, Додають 200 мл етилацетату і одержаний осад відфільтровують. Фільтрат концентрують із одержанням залишку у вигляді масла. Очищення проводять фільтруванням через 40 г силікагелю з використанням 400 мл етилацетату і одержують 10,5 г (47 % від теоретичного значення) 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-4-метил-2-оксо-2-λ⁴-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону у вигляді смоли.

5 $MS [M+H]^+ 280.$

с) Одержання 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-4-метил-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону:



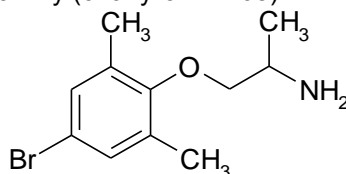
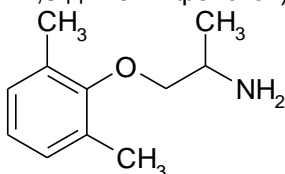
10 До розчину 0,73 г 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-4-метил-2-оксо-2-λ⁴-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону (2,6 ммоль) у 3,8 мл ацетонітрилу при 0 °С додають 0,85 мг гідрату хлориду рутенію(III) і 820 мг (мета)періодату натрію (3,8 ммоль). По краплям додають 3,8 мл води. Реакційну суміш нагрівають до 8 °С і її охолоджують. Одержаний темний суспензії дають нагрітися до температури навколишнього середовища і її перемішують протягом 2 год.,

15 виливають у 40 мл води і екстрагують етилацетатом (2×30 мл). Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують через 5 г силікагелю і розчинник видаляють і одержують 0,63 г (82 % від теоретичного значення) 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-4-метил-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-іл)метанону у вигляді смоли. Сполуку використовують у прикладі Р1 без додаткового очищення

20 ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ 1,51-1,53(d, 3H), 3,98(s, 3H), 4,30-4,34+4,77-4,81(m, 2H), 4,91-4,99(m, 1H), 6,85-7,12(t, 1H), 8,18(s, 1H).

$MS [M+H]^+ 296.$

Приклад Р6: Одержання 2-(2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.166) і 2-(4-бром-2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.168):



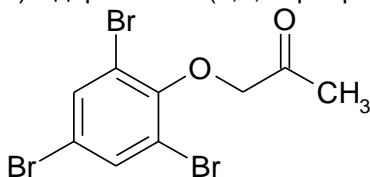
25 соединение Z1.166

соединение Z1.168

У колбі для сульфонування 0,43 г мексилетингідрохлориду (CAS5370-01-4, 2 моля) додають до 10 мл крижаної оцтової кислоти. Одержаний розчин охолоджують до 10 °С. По краплям додають 0,32 г бром (2 ммоль). Реакційну суміш перемішують протягом 14 год. при температурі навколишнього середовища і виливають у воду із льодом. Значення рН суміші доводять до 10 за допомогою 5М NaOH і суміш екстрагують етилацетатом (2×30 мл). Об'єднані етилацетатні шари промивають розсолем, сушать над MgSO₄, фільтрують і сушать сушать при зниженому тиску. 0,42 г суміші складу 1:4 2-(2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.166) і 2-(4-бром-2,6-диметилфенокси)-1-метилетиламіну (сполука Z1.168) одержують у вигляді коричневого масла. Суміш використовують у прикладі Р2 без додаткового очищення.

35 Приклад Р7: 1-Метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)етиламін (сполука Z1.193):

а) Одержання 1-(2,4,6-трибромфенокси)пропан-2-ону



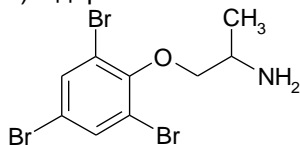
Суміш 5 г 2,4,6-трибромфенолу (15 ммоль), 1,4 г 1-хлорацетон (15 ммоль), 4,16 г безводного карбонату калію (30 ммоль) і 20 мл ДМФ перемішують при 27 °С. Завершення реакції підтверджують за допомогою ТСХ. Реакційну масу розбавляють водою і екстрагують

40

етилацетатом. Органічний шар промивають водою і розсолем, сушать над безводним сульфатом натрію і концентрують і одержують 5,6 г 1-(2,4,6-трибромфенокси)-пропан-2-ону (97 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃):- 2,42 δ (s, 3H), 4,48 δ (s, 2H), 7,67 δ (s, 1H).

5 б) Одержання 1-метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)етиламіну (сполука Z1.193):

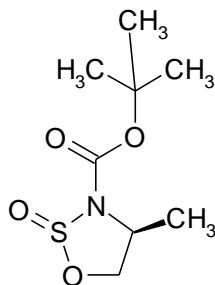


До розчину 1 г 1-(2,4,6-трибромфенокси)пропан-2-ону (2,6 ммоль) в 20 мл метанолу додають 2,9 г ацетату амонію (39 ммоль). Суміш охолоджують до 0 °C і 0,81 г додають цианоборогідрид натрію (13 ммоль). Реакційну суміш перемішують протягом ночі при температурі навколишнього середовища. Завершення реакції підтверджують за допомогою ТСХ. Реакційну суміш концентрують і одержаний залишок розчиняють у 1,5 н. HCl і промивають діетиловим ефіром. Водний шар нейтралізують і екстрагують етилацетатом. Етилацетатний шар сушать над безводним сульфатом натрію і розчинник видаляють. Одержують 0,32 г 1-метил-2-(2,4,6-трибромфенокси)етиламіну (32 %).

15 РХМС- 385,8 / 389,79 / 391,80

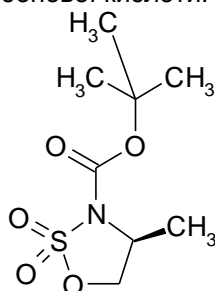
Приклад P8: Одержання (S)-2-(2, 6-диметилфенокси)-1-метилетиламінігдрохлориду (сполука Z1.166 (S-енантіомер)):

Одержання трет-бутилового ефіру (S)-4-метил-2-оксо-2-λ⁴-[1,2,3]оксатіазолідин-3-карбонової кислоти:



20 До охолодженого (-50 °C) розчину SOCl₂ (53 мл, 77 ммоль), імідазолу (18,6 г, 274 ммоль) і Et₃N (20,4 мл, 147 ммоль) у безводному CH₂Cl₂ (550 мл) протягом 0,5 год. по краплям додають розчин (S)-N-Вос-аланінолу (12,0 г, 68 ммоль) у безводному CH₂Cl₂ (150 мл). Потім суміш нагрівають до 0 °C і перемішують протягом 4 год. і потім додають воду (600 мл). Органічну порцію відокремлюють, промивають розсолем (600 мл), сушать (Na₂SO₄) і концентрують у вакуумі і одержують проміжний циклічний сульфамідит (15,14 г, 100 %) у вигляді безбарвного масла. Цю речовину відразу ж використовують на наступній стадії без додаткового очищення.

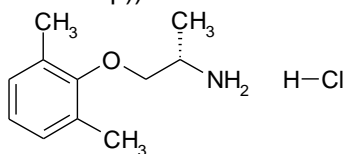
25 б) Одержання трет-бутилового ефіру (S)-4-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-карбонової кислоти:



30 До охолодженого льодом (0 °C) розчину проміжного циклічного сульфамідиту, одержаного на стадії а (15,14 г, 68 ммоль), у MeCN (540 мл) послідовно додають NaIO₄ (72,0 г, 337 ммоль), RuCl₃·H₂O (13 мг) і потім воду (420 мл). Суміш перемішують при 0 °C протягом 2 год. і потім розбавляють водою (900 мл) і екстрагують за допомогою Et₂O (2×1100 мл). Органічні екстракти об'єднують, промивають водою (1200 мл) і потім розсолем (1200 мл), сушать (Na₂SO₄) і концентрують у вакуумі. Залишок фільтрують крізь шар SiO₂ (60, елюючи за допомогою Et₂O) і одержують циклічний сульфамідат 4 (12,6 г, 78 %, співвідношення поворотних ізомерів складає 4:1) у вигляді безбарвної кристалічної твердої речовини; т. пл. 112-120 °C (EtOAc-гексани); [α]_D²⁵+5,29 (c=5,4, CHCl₃); δ_H (400 МГц,

CDCl₃) (дані тільки для головного поворотного ізомеру) 1,50 (3H, d, J=6,5, C4-CH₃), 1,53 (9H, s, NCO₂C(CH₃)₃), 4,00-4,10 (1H, m, C4-H), 4,68 (1H, dd, J=9,5 і 9,0, C3-H), 4,79 (1H, dd, J=9,0 і 7,0, C3-H).

с) Одержання (S)-2-(2, 6-диметилфенокси)-1-метилетиламінігдрохлориду (сполука Z1.166 (S-енантіомер)):

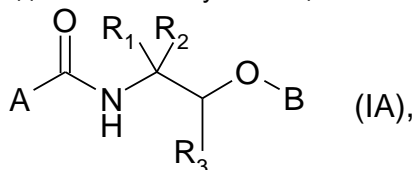


До розчину 2,6-диметилфенолу (122 мг, 1,01 ммоль) у безводному ДМФ (11 мл) додають NaH (50 % дисперсія у мінеральному маслі, 50 мг, 1,01 ммоль) одержану суміш перемішують при температурі навколишнього середовища протягом 10 хв. Додають трет-бутиловий ефір (S)-4-2,2-діоксо-2-λ⁶-[1,2,3]оксатіазолідин-3-карбонової кислоти (200 мг, 0,84 ммоль) у безводному ДМФ (4 мл) і суміш перемішують при КТ протягом 3 год. і потім концентрують у вакуумі. Залишок суспендують у діоксані (6 мл), додають воду (100 мкл) і концентровану H₂SO₄ (100 мкл) і суміш перемішують при температурі навколишнього середовища протягом 0,5 год. Додають ще концентровану H₂SO₄ (100 мкл) і суміш перемішують при температурі навколишнього середовища протягом ще 0,5 год. Суміш нейтралізують насиченим водним розчином NaHCO₃ і екстрагують за допомогою CH₂Cl₂ (3×30 мл Об'єднані органічні екстракти концентрують у вакуумі і одержують неочищений амін (200 мг) у вигляді коричневатого масла. Цю неочищену речовину розчиняють у діетиловому ефірі (3 мл) і обробляють за допомогою 1 н. HCl у діетиловому ефірі і одержують осад. Тверду речовину відфільтровують і сушать у вакуумі і одержують (55 мг; 37 %) чистого (S)-2-(2, 6-диметилфенокси)-1-метилетиламінігдрохлориду у вигляді білої твердої речовини (т. пл. 190-193 °C). [α]_D²⁴+2,6 (с=1,0, MeOH).

Потім сполуку Z1.166 (S-енантіомер) перетворюють у сполуку 1.166 (S-енантіомер) за відомими методиками.

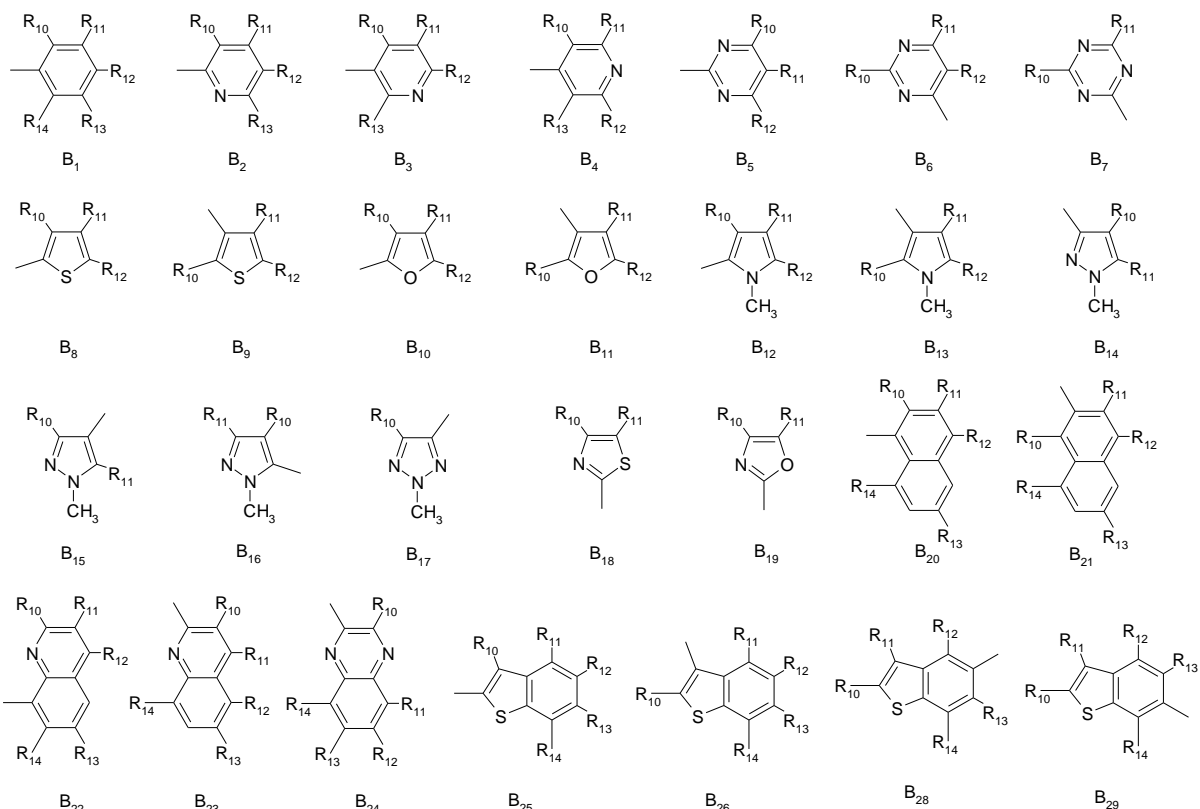
Таблиці 1-7: Сполуки формули IA

Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (IA), наведеними нижче у таблицях 1-7. Характеристики наведені у таблиці 12.



де

B є однією з бажаних груп B1-B26, B28 або B29:



У кожній з таблиць 1-7, які наведені нижче після таблиці Y, наведені 643 сполуки формули (IA), в якій R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ мають значення, наведені в таблиці Y, і A має значення, наведене у відповідній таблиці 1-7. Таким чином, таблиця 1 відповідає таблиці Y, коли Y дорівнює 1 і A має значення, наведене у заголовку таблиці 1, таблиця 2 відповідає таблиці Y, коли Y дорівнює 2 і A має значення, наведене у заголовку таблиці 2, і так далі для таблиць 3-7.

У наведених нижче таблицях 1-11 "Me" означає метил, "Et" означає етил, "i-Pr" означає ізопропіл, "c-Pr" означає циклопропіл і "t-Bu" означає трет-бутил.

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.001	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	H
Y.002	H	H	H	B1	Cl	Cl	H	H	H
Y.003	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Y.004	H	H	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Y.005	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.006	H	H	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Y.007	H	H	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Y.008	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.009	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Y.010	H	H	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Y.011	H	H	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Y.012	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Y.013	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Y.014	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Y.015	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Y.016	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Y.017	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-i-Pr	H	Cl
Y.018	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Y.019	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-p-Cl-феніл	H	Cl
Y.020	H	H	H	B1	Cl	H	p-Cl-феніл	H	Cl
Y.021	H	H	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl

Таблица Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.022	H	H	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Y.023	H	H	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Y.024	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Y.025	H	H	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Y.026	H	H	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Y.027	H	H	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Y.028	H	H	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Y.029	H	H	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Y.030	H	H	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Y.031	H	H	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Y.032	H	H	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Y.033	H	H	H	B1	Cl	H	p-Cl-фенокси	H	Cl
Y.034	H	H	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Y.035	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Y.036	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Y.037	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Y.038	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Y.039	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Y.040	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Y.041	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Y.042	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Y.043	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Y.044	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Y.045	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Y.046	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Y.047	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Y.048	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Y.049	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Y.050	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Y.051	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Y.052	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Y.053	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Y.054	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Y.055	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Y.056	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Y.057	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Y.058	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Y.059	H	H	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Y.060	H	H	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Y.061	H	H	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Y.062	H	H	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Y.063	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Y.064	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Y.065	H	H	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Y.066	H	H	H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.067	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Y.068	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.069	H	H	H	B1	Me	H	I	H	Me
Y.070	H	H	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Y.071	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Y.072	H	H	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Y.073	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Y.074	H	H	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Y.075	H	H	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.076	H	H	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Y.077	H	H	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Y.078	H	H	H	B1	Me	H	p-Cl-феніл	H	Me
Y.079	H	H	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Y.080	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Y.081	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Y.082	H	H	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Y.083	H	H	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Y.084	H	H	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Y.085	H	H	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Y.086	H	H	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Y.087	H	H	H	B1	t-Bu	H	Br	H	t-Bu
Y.088	H	H	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Y.089	H	H	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Y.090	H	H	H	B1	t-Bu	H	OMe	H	t-Bu
Y.091	H	H	H	B1	Br	H	H	H	Br
Y.092	H	H	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Y.093	H	H	H	B1	F	H	H	H	F
Y.094	H	H	H	B1	F	H	Cl	H	F
Y.095	H	H	H	B1	F	H	Br	H	F
Y.096	H	H	H	B1	I	H	H	H	I
Y.097	H	H	H	B1	I	H	Cl	H	I
Y.098	H	Me	H	B1	H	H	COMe	H	H
Y.099	H	Me	H	B1	H	F	H	F	H
Y.100	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	H
Y.101	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Y.102	H	Me	H	B1	H	t-Bu	H	t-Bu	H
Y.103	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Y.104	H	Me	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Y.105	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.106	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Y.107	H	Me	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Y.108	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.109	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Y.110	H	Me	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Y.111	H	Me	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Y.112	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Y.113	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Y.114	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Y.115	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Y.116	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Y.117	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-C-i-Pr	H	Cl
Y.118	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Y.119	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-p-Cl-феніл	H	Cl
Y.120	H	Me	H	B1	Cl	H	p-Cl-феніл	H	Cl
Y.121	H	Me	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Y.122	H	Me	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Y.123	H	Me	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Y.124	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Y.125	H	Me	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Y.126	H	Me	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Y.127	H	Me	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Y.128	H	Me	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Y.129	H	Me	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.130	H	Me	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Y.131	H	Me	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Y.132	H	Me	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Y.133	H	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Y.134	H	Me	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Y.135	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Y.136	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Y.137	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Y.138	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Y.139	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Y.140	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Y.141	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Y.142	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Y.143	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Y.144	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Y.145	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Y.146	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Y.147	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Y.148	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Y.149	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Y.150	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Y.151	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Y.152	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Y.153	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Y.154	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Y.155	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Y.156	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Y.157	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Y.158	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Y.159	H	Me	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Y.160	H	Me	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Y.161	H	Me	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Y.162	H	Me	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Y.163	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Y.164	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Y.165	H	Me	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Y.166	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.167	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Y.168	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.169	H	Me	H	B1	Me	H	I	H	Me
Y.170	H	Me	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Y.171	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Y.172	H	Me	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Y.173	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Y.174	H	Me	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Y.175	H	Me	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Y.176	H	Me	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Y.177	H	Me	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Y.178	H	Me	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Y.179	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Y.180	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Y.181	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Y.182	H	Me	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Y.183	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.184	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Y.185	H	Me	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Y.186	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Y.187	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Y.188	H	Me	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Y.189	H	Me	H	B1	t-Bu	H	p-Cl-феніл	H	t-Bu
Y.190	H	Me	H	B1	H	H	CF ₃	H	H
Y.191	H	Me	H	B1	H	H	Br	H	H
Y.192	H	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Y.193	H	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Y.194	H	Me	H	B1	F	H	H	H	F
Y.195	H	Me	H	B1	F	H	Cl	H	F
Y.196	H	Me	H	B1	F	H	Br	H	F
Y.197	H	Me	H	B1	I	H	H	H	I
Y.198	H	Me	H	B1	I	H	Cl	H	I
Y.199	H	Me	H	B1	I	H	Br	H	I
Y.200	H	Me	H	B1	I	H	I	H	I
Y.201	H	Me	Me	B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.202	H	Me	Me	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.203	H	Me	Me	B1	Br	H	H	H	Br
Y.204	H	Me	Me	B1	Br	H	Br	H	Br
Y.205	H	Me	Me	B1	Me	H	H	H	Me
Y.206	H	Me	Me	B1	Me	H	Cl	H	Me
Y.207	H	Me	Me	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.208	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.209	Me	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.210	Me	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Y.211	Me	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Y.212	Me	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Y.213	Me	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.214	i-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.215	c-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.216	Et	Et	H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.217	Et	Et	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.218	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	H
Y.219	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	H	H	Me
Y.220	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	Br	H	Me
Y.221	CH ₂ CH ₂		H	B1	H	H	Cl	H	H
Y.222	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Y.223	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.224	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.225	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	H	H	Br
Y.226	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	Br	H	Br
Y.227	H	CH ₂		B1	Me	H	H	H	Me
Y.228	H	CH ₂		B1	Me	H	Br	H	Me
Y.229	H	CH ₂		B1	H	H	Cl	H	H
Y.230	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	H
Y.231	H	CH ₂		B1	Cl	H	H	H	Cl
Y.232	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Y.233	H	CH ₂		B1	Br	H	H	H	Br
Y.234	H	CH ₂		B1	Br	H	Br	H	Br
Y.235	H	H	H	B2	Cl	H	Cl	H	-
Y.236	H	H	H	B2	Cl	H	Br	H	-
Y.237	H	H	H	B2	Br	H	Br	H	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.238	H	H	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.239	H	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.240	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.241	Me	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.242	H	H	Me	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.243	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.244	CH ₂ CH ₂		H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.245	H	CH ₂		B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Y.246	H	H	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Y.247	H	H	H	B3	Cl	H	H	Br	-
Y.248	H	H	H	B3	Cl	H	H	I	-
Y.249	H	H	H	B3	Cl	H	H	Me	-
Y.250	H	H	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Y.251	H	H	H	B3	Me	H	H	Br	-
Y.252	H	H	H	B3	Me	H	H	Me	-
Y.253	H	Me	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Y.254	H	Me	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Y.255	H	H	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Y.256	H	H	H	B4	Br	H	H	Br	-
Y.247	H	H	H	B4	Me	H	H	Me	-
Y.258	H	Me	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Y.259	H	Me	H	B4	Br	H	H	Br	-
Y.260	H	Me	H	B4	Me	H	H	Me	-
Y.261	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Y.262	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Y.263	H	H	H	B5	H	Me	H	-	-
Y.264	H	H	H	B5	H	Cl	H	-	-
Y.265	H	H	H	B5	H	Br	H	-	-
Y.266	H	H	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Y.267	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Y.268	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Y.269	H	Me	H	B5	H	Me	H	-	-
Y.270	H	Me	H	B5	H	Cl	H	-	-
Y.271	H	Me	H	B5	H	Br	H	-	-
Y.272	H	Me	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Y.273	H	H	H	B6	Cl	H	Cl	-	-
Y.274	H	H	H	B6	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.275	H	H	H	B6	Cl	Me	Cl	-	-
Y.276	H	Me	H	B6	Cl	H	Cl	-	-
Y.277	H	Me	H	B6	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.278	H	Me	H	B6	Cl	Me	Cl	-	-
Y.279	H	H	H	B7	Cl	H	-	-	-
Y.280	H	H	H	B7	Cl	Cl	-	-	-
Y.281	H	H	H	B7	Me	Me	-	-	-
Y.282	H	H	H	B7	OMe	Me	-	-	-
Y.283	H	H	H	B7	OMe	Cl	-	-	-
Y.284	H	H	H	B7	NHMe	Cl	-	-	-
Y.285	H	Me	H	B7	Cl	H	-	-	-
Y.286	H	Me	H	B7	Cl	Cl	-	-	-
Y.287	H	Me	H	B7	Me	Me	-	-	-
Y.288	H	Me	H	B7	OMe	Me	-	-	-
Y.289	H	Me	H	B7	OMe	Cl	-	-	-
Y.290	H	Me	H	B7	NHMe	Cl	-	-	-
Y.291	H	H	H	B8	Cl	H	H	-	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.292	H	H	H	B8	Cl	Cl	H	-	-
Y.293	H	H	H	B8	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.294	H	H	H	B8	Cl	H	Cl	-	-
Y.295	H	H	H	B8	Me	H	H	-	-
Y.296	H	H	H	B8	Me	Cl	H	-	-
Y.297	H	H	H	B8	Me	Cl	Cl	-	-
Y.298	H	H	H	B8	Me	Me	H	-	-
Y.299	H	H	H	B8	Me	H	Me	-	-
Y.300	H	H	H	B8	Me	Me	Cl	-	-
Y.301	H	H	H	B8	Me	Me	Me	-	-
Y.302	H	Me	H	B8	Cl	H	H	-	-
Y.303	H	Me	H	B8	Cl	Cl	H	-	-
Y.304	H	Me	H	B8	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.305	H	Me	H	B8	Cl	H	Cl	-	-
Y.306	H	Me	H	B8	Me	H	H	-	-
Y.307	H	Me	H	B8	Me	Cl	H	-	-
Y.308	H	Me	H	B8	Me	Cl	Cl	-	-
Y.309	H	Me	H	B8	Me	Me	H	-	-
Y.310	H	Me	H	B8	Me	H	Me	-	-
Y.311	H	Me	H	B8	Me	Me	Cl	-	-
Y.312	H	Me	H	B8	Me	Me	Me	-	-
Y.313	H	H	H	B9	Cl	Cl	H	-	-
Y.314	H	H	H	B9	Cl	Cl	H	-	-
Y.315	H	H	H	B9	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.316	H	H	H	B9	Cl	Me	H	-	-
Y.317	H	H	H	B9	Cl	Me	Cl	-	-
Y.318	H	H	H	B9	Cl	Me	Me	-	-
Y.319	H	H	H	B9	Cl	Cl	Me	-	-
Y.320	H	H	H	B9	Me	Cl	H	-	-
Y.321	H	H	H	B9	Me	Cl	Cl	-	-
Y.322	H	H	H	B9	Me	Cl	Me	-	-
Y.323	H	H	H	B9	Me	Me	H	-	-
Y.324	H	H	H	B9	Me	Me	Cl	-	-
Y.325	H	H	H	B9	Me	Me	Me	-	-
Y.326	H	Me	H	B9	Cl	Cl	H	-	-
Y.327	H	Me	H	B9	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.328	H	Me	H	B9	Cl	Me	H	-	-
Y.329	H	Me	H	B9	Cl	Me	Cl	-	-
Y.330	H	Me	H	B9	Cl	Me	Me	-	-
Y.331	H	Me	H	B9	Cl	Cl	Me	-	-
Y.332	H	Me	H	B9	Me	Cl	H	-	-
Y.333	H	Me	H	B9	Me	Cl	Cl	-	-
Y.334	H	Me	H	B9	Me	Cl	Me	-	-
Y.335	H	Me	H	B9	Me	Me	H	-	-
Y.336	H	Me	H	B9	Me	Me	Cl	-	-
Y.337	H	Me	H	B9	Me	Me	Me	-	-
Y.338	H	H	H	B10	Cl	H	H	-	-
Y.339	H	H	B	B10	Cl	Cl	H	-	-
Y.340	H	H	H	B10	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.341	H	H	H	B10	Cl	H	Cl	-	-
Y.342	H	H	H	B10	Me	H	H	-	-
Y.343	H	H	H	B10	Me	Cl	H	-	-
Y.344	H	H	H	B10	Me	Cl	Cl	-	-
Y.345	H	H	H	B10	Me	Me	H	-	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.346	H	H	H	B10	Me	H	Me	-	-
Y.347	H	H	H	B10	Me	Me	Cl	-	-
Y.348	H	H	H	B10	Me	Me	Me	-	-
Y.349	H	Me	H	B10	Cl	H	H	-	-
Y.350	H	Me	H	B10	Cl	Cl	H	-	-
Y.351	H	Me	H	B10	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.352	H	Me	H	B10	Cl	H	Cl	-	-
Y.353	H	Me	H	B10	Me	H	H	-	-
Y.354	H	Me	H	B10	Me	Cl	H	-	-
Y.355	H	Me	H	B10	Me	Cl	Cl	-	-
Y.356	H	Me	H	B10	Me	Me	H	-	-
Y.347	H	Me	H	B10	Me	H	Me	-	-
Y.358	H	Me	H	B10	Me	Me	Cl	-	-
Y.359	H	Me	H	B10	Me	Me	Me	-	-
Y.360	H	H	H	B11	Cl	Cl	H	-	-
Y.361	H	H	H	B11	Cl	Cl	H	-	-
Y.362	H	H	H	B11	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.363	H	H	H	B11	Cl	Me	H	-	-
Y.364	H	H	H	B11	Cl	Me	Cl	-	-
Y.365	H	H	H	B11	Cl	Me	Me	-	-
Y.366	H	H	H	B11	Cl	Cl	Me	-	-
Y.367	H	H	H	B11	Me	Cl	H	-	-
Y.368	H	H	H	B11	Me	Cl	Cl	-	-
Y.369	H	H	H	B11	Me	Cl	Me	-	-
Y.370	H	H	H	B11	Me	Me	H	-	-
Y.371	H	H	H	B11	Me	Me	Cl	-	-
Y.372	H	H	H	B11	Me	Me	Me	-	-
Y.373	H	Me	H	B11	Cl	Cl	H	-	-
Y.374	H	Me	H	B11	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.375	H	Me	H	B11	Cl	Me	H	-	-
Y.376	H	Me	H	B11	Cl	Me	Cl	-	-
Y.377	H	Me	H	B11	Cl	Me	Me	-	-
Y.378	H	Me	H	B11	Cl	Cl	Me	-	-
Y.379	H	Me	H	B11	Me	Cl	H	-	-
Y.380	H	Me	H	B11	Me	Cl	Cl	-	-
Y.381	H	Me	H	B11	Me	Cl	Me	-	-
Y.382	H	Me	H	B11	Me	Me	H	-	-
Y.383	H	Me	H	B11	Me	Me	Cl	-	-
Y.384	H	Me	H	B11	Me	Me	Me	-	-
Y.385	H	H	H	B12	Cl	H	H	-	-
Y.386	H	H	H	B12	Cl	Cl	H	-	-
Y.387	H	H	H	B12	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.388	H	H	H	B12	Cl	H	Cl	-	-
Y.389	H	H	H	B12	Me	H	H	-	-
Y.390	H	H	H	B12	Me	Cl	H	-	-
Y.391	H	H	H	B12	Me	Cl	Cl	-	-
Y.392	H	H	H	B12	Me	Me	H	-	-
Y.393	H	H	H	B12	Me	H	Me	-	-
Y.394	H	H	H	B12	Me	Me	Cl	-	-
Y.395	H	H	H	B12	Me	Me	Me	-	-
Y.396	H	Me	H	B12	Cl	H	H	-	-
Y.397	H	Me	H	B12	Cl	Cl	H	-	-
Y.398	H	Me	H	B12	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.399	H	Me	H	B12	Cl	H	Cl	-	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.400	H	Me	H	B12	Me	H	H	-	-
Y.401	H	Me	H	B12	Me	Cl	H	-	-
Y.402	H	Me	H	B12	Me	Cl	Cl	-	-
Y.403	H	Me	H	B12	Me	Me	H	-	-
Y.404	H	Me	H	B12	Me	H	Me	-	-
Y.405	H	Me	H	B12	Me	Me	Cl	-	-
Y.406	H	Me	H	B12	Me	Me	Me	-	-
Y.407	H	H	H	B13	Cl	Cl	H	-	-
Y.408	H	H	H	B13	Cl	Cl	H	-	-
Y.409	H	H	H	B13	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.410	H	H	H	B13	Cl	Me	H	-	-
Y.411	H	H	H	B13	Cl	Me	Cl	-	-
Y.412	H	H	H	B13	Cl	Me	Me	-	-
Y.413	H	H	H	B13	Cl	Cl	Me	-	-
Y.414	H	H	H	B13	Me	Cl	H	-	-
Y.415	H	H	H	B13	Me	Cl	Cl	-	-
Y.416	H	H	H	B13	Me	Cl	Me	-	-
Y.417	H	H	H	B13	Me	Me	H	-	-
Y.418	H	H	H	B13	Me	Me	Cl	-	-
Y.419	H	H	H	B13	Me	Me	Me	-	-
Y.420	H	Me	H	B13	Cl	Cl	H	-	-
Y.421	H	Me	H	B13	Cl	Cl	Cl	-	-
Y.422	H	Me	H	B13	Cl	Me	H	-	-
Y.423	H	Me	H	B13	Cl	Me	Cl	-	-
Y.424	H	Me	H	B13	Cl	Me	Me	-	-
Y.425	H	Me	H	B13	Cl	Cl	Me	-	-
Y.426	H	Me	H	B13	Me	Cl	H	-	-
Y.427	H	Me	H	B13	Me	Cl	Cl	-	-
Y.428	H	Me	H	B13	Me	Cl	Me	-	-
Y.429	H	Me	H	B13	Me	Me	H	-	-
Y.430	H	Me	H	B13	Me	Me	Cl	-	-
Y.431	H	Me	H	B13	Me	Me	Me	-	-
Y.432	H	H	H	B14	Cl	H	-	-	-
Y.433	H	H	H	B14	Cl	Me	-	-	-
Y.434	H	H	H	B14	Br	H	-	-	-
Y.435	H	H	H	B14	Br	Me	-	-	-
Y.436	H	H	H	B14	Me	H	-	-	-
Y.437	H	H	H	B14	Me	Me	-	-	-
Y.438	H	H	H	B14	CF ₃	H	-	-	-
Y.439	H	H	H	B14	CF ₃	Me	-	-	-
Y.440	H	H	H	B14	OMe	H	-	-	-
Y.441	H	H	H	B14	OMe	Me	-	-	-
Y.442	H	Me	H	B14	Cl	H	-	-	-
Y.443	H	Me	H	B14	Cl	Me	-	-	-
Y.444	H	Me	H	B14	Br	H	-	-	-
Y.445	H	Me	H	B14	Br	Me	-	-	-
Y.446	H	Me	H	B14	Me	H	-	-	-
Y.447	H	Me	H	B14	Me	Me	-	-	-
Y.448	H	Me	H	B14	CF ₃	H	-	-	-
Y.449	H	Me	H	B14	CF ₃	Me	-	-	-
Y.450	H	Me	H	B14	OMe	H	-	-	-
Y.451	H	Me	H	B14	OMe	Me	-	-	-
Y.452	H	H	H	B15	Cl	Cl	-	-	-
Y.453	H	H	H	B15	Me	Me	-	-	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.454	H	H	H	B15	Br	Br	-	-	-
Y.455	H	H	H	B15	CF ₃	CF ₃	-	-	-
Y.456	H	H	H	B15	OMe	Cl	-	-	-
Y.457	H	Me	H	B15	Cl	Cl	-	-	-
Y.458	H	Me	H	B15	Me	Me	-	-	-
Y.459	H	Me	H	B15	Br	Br	-	-	-
Y.460	H	Me	H	B15	CF ₃	CF ₃	-	-	-
Y.461	H	Me	H	B15	OMe	Cl	-	-	-
Y.462	H	H	H	B16	Cl	H	-	-	-
Y.463	H	H	H	B16	Cl	Cl	-	-	-
Y.464	H	H	H	B16	Br	H	-	-	-
Y.465	H	H	H	B16	Br	Br	-	-	-
Y.466	H	H	H	B16	Me	H	-	-	-
Y.467	H	H	H	B16	Me	Me	-	-	-
Y.468	H	H	H	B16	CF ₃	H	-	-	-
Y.469	H	H	H	B16	CF ₃	CF ₃	-	-	-
Y.470	H	Me	H	B16	Cl	H	-	-	-
Y.471	H	Me	H	B16	Cl	Cl	-	-	-
Y.472	H	Me	H	B16	Br	H	-	-	-
Y.473	H	Me	H	B16	Br	Br	-	-	-
Y.474	H	Me	H	B16	Me	H	-	-	-
Y.475	H	Me	H	B16	Me	Me	-	-	-
Y.476	H	Me	H	B16	CF ₃	H	-	-	-
Y.477	H	Me	H	B16	CF ₃	CF ₃	-	-	-
Y.478	H	H	H	B17	Cl	-	-	-	-
Y.479	H	H	H	B17	Br	-	-	-	-
Y.480	H	H	H	B17	Me	-	-	-	-
Y.481	H	H	H	B17	CF ₃	-	-	-	-
Y.482	H	Me	H	B17	Cl	-	-	-	-
Y.483	H	Me	H	B17	Br	-	-	-	-
Y.484	H	Me	H	B17	Me	-	-	-	-
Y.485	H	Me	H	B17	CF ₃	-	-	-	-
Y.486	H	H	H	B18	Cl	H	-	-	-
Y.487	H	H	H	B18	Br	H	-	-	-
Y.488	H	H	H	B18	Me	H	-	-	-
Y.489	H	H	H	B18	CF ₃	H	-	-	-
Y.490	H	H	H	B18	Cl	Me	-	-	-
Y.491	H	H	H	B18	Br	Me	-	-	-
Y.492	H	H	H	B18	Me	Me	-	-	-
Y.493	H	H	H	B18	CF ₃	Me	-	-	-
Y.494	H	Me	H	B18	Cl	H	-	-	-
Y.495	H	Me	H	B18	Br	H	-	-	-
Y.496	H	Me	H	B18	Me	H	-	-	-
Y.497	H	Me	H	B18	CF ₃	H	-	-	-
Y.498	H	Me	H	B18	Cl	Me	-	-	-
Y.499	H	Me	H	B18	Br	Me	-	-	-
Y.500	H	Me	H	B18	Me	Me	-	-	-
Y.501	H	Me	H	B18	CF ₃	Me	-	-	-
Y.502	H	H	H	B19	Cl	H	-	-	-
Y.503	H	H	H	B19	Br	H	-	-	-
Y.504	H	H	H	B19	Me	H	-	-	-
Y.505	H	H	H	B19	CF ₃	H	-	-	-
Y.506	H	H	H	B19	Cl	Me	-	-	-
Y.507	H	H	H	B19	Br	Me	-	-	-

Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.508	H	H	H	B19	Me	Me	-	-	-
Y.509	H	H	H	B19	CF ₃	Me	-	-	-
Y.510	H	Me	H	B19	Cl	H	-	-	-
Y.511	H	Me	H	B19	Br	H	-	-	-
Y.512	H	Me	H	B19	Me	H	-	-	-
Y.513	H	Me	H	B19	CF ₃	H	-	-	-
Y.514	H	Me	H	B19	Cl	Me	-	-	-
Y.515	H	Me	H	B19	Br	Me	-	-	-
Y.516	H	Me	H	B19	Me	Me	-	-	-
Y.517	H	Me	H	B19	CF ₃	Me	-	-	-
Y.518	H	H	H	B20	Cl	H	H	H	H
Y.519	H	H	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Y.520	H	H	H	B20	Br	H	H	H	H
Y.521	H	H	H	B20	Br	H	Br	H	H
Y.522	H	H	H	B20	Me	H	H	H	H
Y.523	H	H	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Y.524	H	H	H	B20	COMe	H	H	H	H
Y.525	H	H	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Y.526	H	Me	H	B20	Cl	H	H	H	H
Y.527	H	Me	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Y.528	H	Me	H	B20	Br	H	H	H	H
Y.529	H	Me	H	B20	Br	H	Br	H	H
Y.530	H	Me	H	B20	Me	H	H	H	H
Y.531	H	Me	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Y.532	H	Me	H	B20	COMe	H	H	H	H
Y.533	H	Me	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Y.534	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Y.535	H	H	H	B21	H	Cl	H	H	H
Y.536	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Y.537	H	H	H	B21	H	H	H	Cl	H
Y.538	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Y.539	H	H	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Y.540	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Y.541	H	H	H	B21	Br	H	H	H	H
Y.542	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Y.543	H	H	H	B21	Me	H	H	H	H
Y.544	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Y.545	H	H	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Y.546	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Y.547	H	H	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Y.548	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Y.549	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Y.550	H	Me	H	B21	H	Cl	H	H	H
Y.551	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Y.552	H	Me	H	B21	H	H	H	Cl	H
Y.553	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Y.554	H	Me	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Y.555	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Y.556	H	Me	H	B21	Br	H	H	H	H
Y.557	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Y.558	H	Me	H	B21	Me	H	H	H	H
Y.559	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Y.560	H	Me	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Y.561	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H

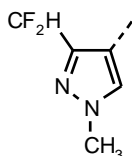
Таблица Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.562	H	Me	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Y.563	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Y.564	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	Br	H
Y.565	H	Me	H	B21	Br	Br	H	H	H
Y.566	H	Me	H	B21	Br	Br	H	Br	H
Y.567	H	Me	H	B21	Me	Me	H	H	H
Y.568	H	Me	H	B21	Me	Me	H	Cl	H
Y.569	H	Me	H	B21	Me	Me	H	Br	H
Y.570	H	H	H	B22	Me	H	H	H	H
Y.571	H	H	H	B22	H	H	H	H	Cl
Y.572	H	H	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Y.573	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Y.574	H	H	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Y.575	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Y.576	H	H	H	B22	H	H	H	H	Br
Y.577	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Y.578	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Br
Y.579	H	H	H	B22	H	H	H	Br	Br
Y.580	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	H
Y.581	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Cl
Y.582	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Y.583	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Y.584	H	Me	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Y.585	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Y.586	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Br
Y.587	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Y.588	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Br
Y.589	H	Me	H	B22	H	H	H	Br	Br
Y.590	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	H
Y.591	H	H	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Y.592	H	H	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Y.593	H	H	H	B23	Me	H	H	H	H
Y.594	H	H	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Y.595	H	H	H	B23	Me	Me	H	H	H
Y.596	H	H	H	B23	H	H	H	H	Me
Y.597	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Y.598	H	H	H	B23	Me	H	H	H	Me
Y.599	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	H
Y.600	H	Me	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Y.601	H	Me	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Y.602	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	H
Y.603	H	Me	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Y.604	H	Me	H	B23	Me	Me	H	H	H
Y.605	H	Me	H	B23	H	H	H	H	Me
Y.606	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Y.607	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	Me
Y.608	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	H
Y.609	H	H	H	B24	Br	H	H	H	H
Y.610	H	H	H	B24	CN	H	H	H	H
Y.611	H	H	H	B24	Me	H	H	H	H
Y.612	H	H	H	B24	OMe	H	H	H	H
Y.613	H	H	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Y.614	H	H	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Y.615	H	H	H	B24	CN	H	Cl	H	H

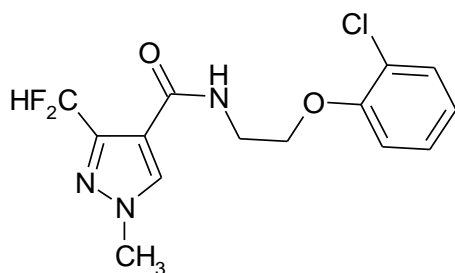
Таблиця Y

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Y.616	H	H	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Y.617	H	H	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Y.618	H	H	H	B24	Cl	H	F	H	H
Y.619	H	H	H	B24	Br	H	F	H	H
Y.620	H	H	H	B24	CN	H	F	H	H
Y.621	H	H	H	B24	Me	H	F	H	H
Y.622	H	H	H	B24	OMe	H	F	H	H
Y.623	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	F
Y.624	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	H
Y.625	H	Me	H	B24	Br	H	H	H	H
Y.626	H	Me	H	B24	CN	H	H	H	H
Y.627	H	Me	H	B24	Me	H	H	H	H
Y.628	H	Me	H	B24	OMe	H	H	H	H
Y.629	H	Me	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Y.630	H	Me	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Y.631	H	Me	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Y.632	H	Me	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Y.633	H	Me	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Y.634	H	Me	H	B24	Cl	H	F	H	H
Y.635	H	Me	H	B24	Br	H	F	H	H
Y.636	H	Me	H	B24	CN	H	F	H	H
Y.637	H	Me	H	B24	Me	H	F	H	H
Y.638	H	Me	H	B24	OMe	H	F	H	H
Y.639	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	F
Y.640	H	Me	H	B25	Me	H	H	H	H
Y.641	H	Me	H	B25	Cl	H	H	H	H
Y.642	H	Me	H	B25	OMe	H	H	H	H
Y.643	H	Me	H	B26	Me	H	H	H	H
Y.644	H	Me	H	B26	Cl	H	H	H	H
Y.645	H	Me	H	B26	OMe	H	H	H	H
Y.646	H	Me	H	B28	H	H	Me	Me	H
Y.647	H	Me	H	B28	Me	Me	Me	Me	H
Y.648	H	Me	H	B28	H	H	Cl	Cl	H
Y.649	H	Me	H	B28	H	H	Br	Br	H
Y.650	H	Me	H	B28	H	H	Cl	Br	H
Y.651	H	Me	H	B28	H	H	Cl	H	H
Y.652	H	Me	H	B29	H	H	H	Me	Me
Y.653	H	Me	H	B29	Me	Me	H	Me	Me

У таблиці 1 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій A означає

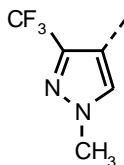


- 5 де штрихові лінії вказують положення приєднання групи A до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y. Наприклад, сполука 1.001 має наступну структуру:



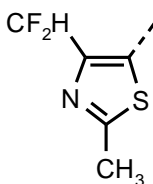
(1.001).

У таблиці 2 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



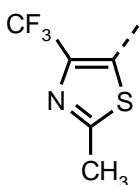
5 де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

У таблиці 3 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



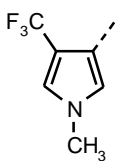
10 де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

У таблиці 4 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



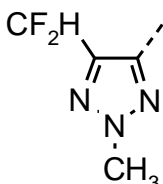
де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

У таблиці 5 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



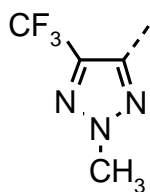
15 де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

У таблиці 6 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



20 де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

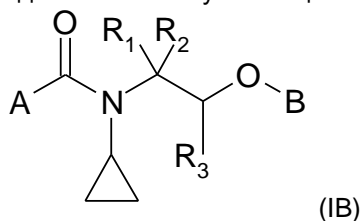
У таблиці 7 наведені 653 сполуки формули (IA), в якій А означає



де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R_1 , R_2 , R_3 , В, R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} є такими, як визначено у таблиці Y.

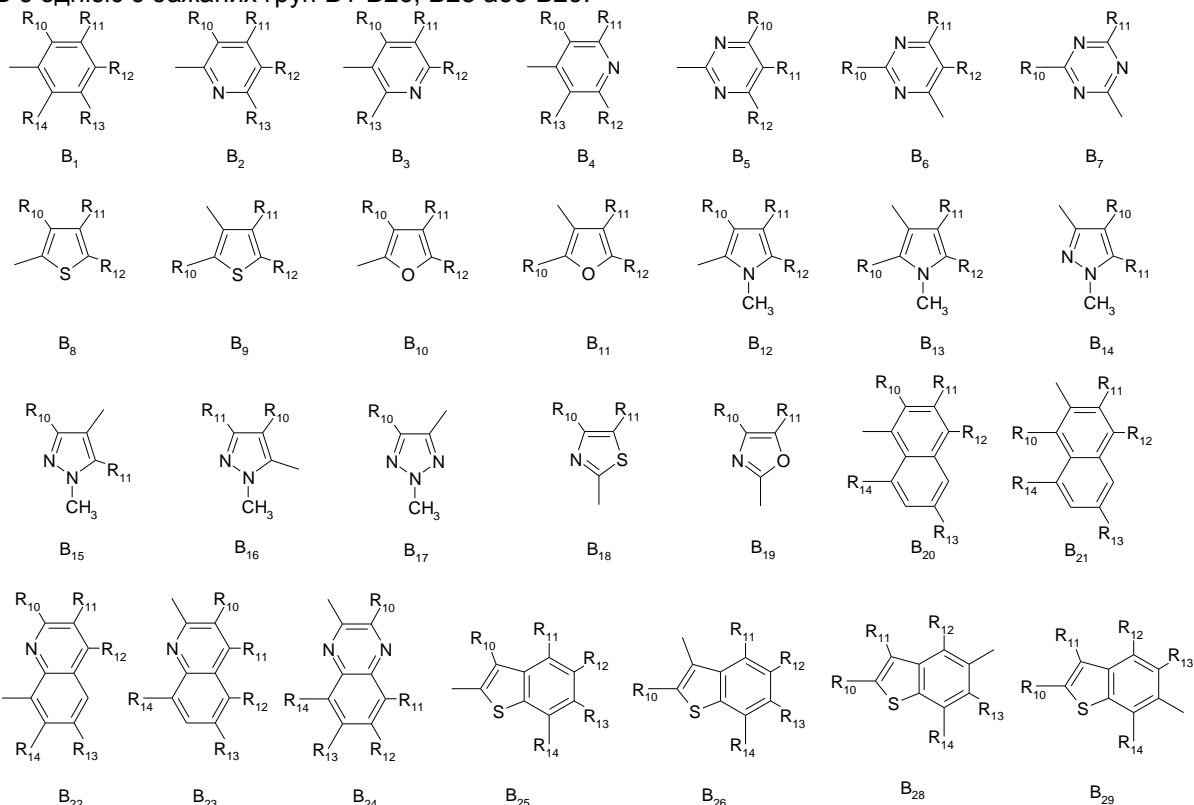
Таблиці 1а-7а: Сполуки формули IB

- 5 Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (IB), наведеними нижче у таблицях 1а-7а.



в якій

В є однією з бажаних груп В1-В26, В28 або В29:

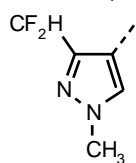


10

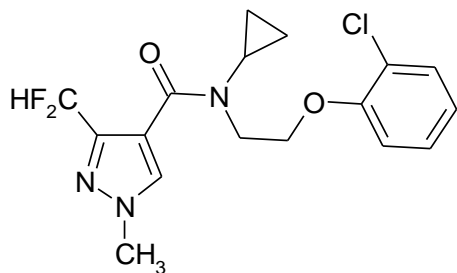
У кожній з таблиць 1 а-7а, які наведені нижче після таблиці Y, наведені 653 сполуки формули (IB), в якій R_1 , R_2 , R_3 , В, R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} і R_{14} мають значення, наведені у таблиці Y і А має значення, наведене у відповідній таблиці 1 а-7а. Таким чином, таблиця 1а відповідає таблиці Y, коли Y дорівнює 1а і А має значення, наведене у заголовку таблиці 1а, таблиця 2а відповідає таблиці Y, коли Y дорівнює 2а і А має значення, наведене у заголовку таблиці 2а, і так далі для таблиць 3 а-7а.

15

У таблиці 1а наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



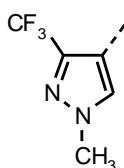
де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y. Наприклад, сполука 1a.001 має наступну структуру:



(1a.001)

5

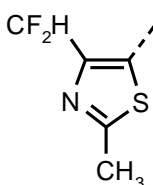
У таблиці 2a наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

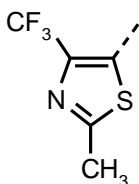
10

У таблиці 3a наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

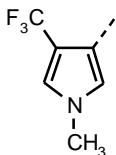
У таблиці 4a наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



15

де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

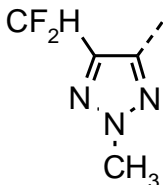
У таблиці 5a наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



20

де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

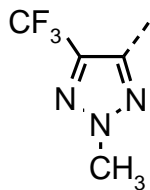
У таблиці 6a наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає



25

де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

У таблиці 7а наведені 653 сполуки формули (IB), в якій А означає

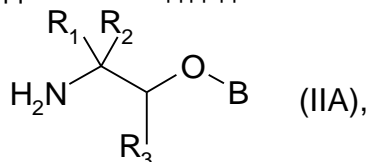


де штрихові лінії вказують положення приєднання групи А до амідної групи і R₁, R₂, R₃, B, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ і R₁₄ є такими, як визначено у таблиці Y.

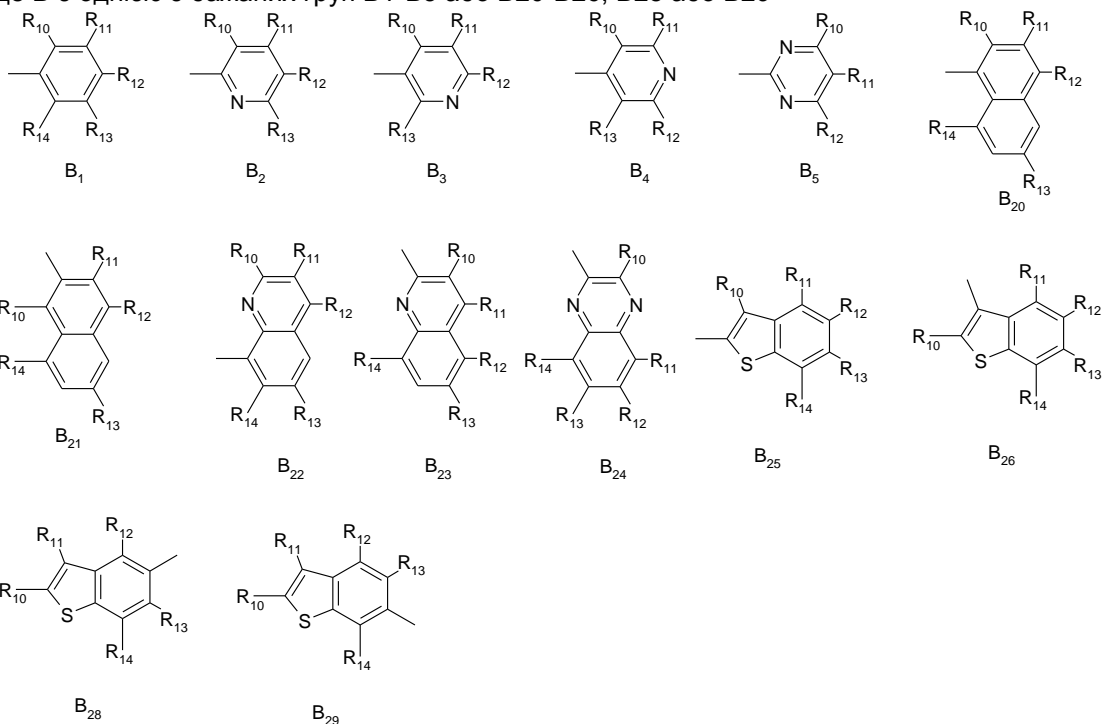
5

Таблиця 8: Сполуки формули IIA

Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (IIA)



де В є однією з бажаних груп B1-B5 або B20-B26, B28 або B29



10

Сполуки формули (IIA) наведені нижче у таблиці 8. Характеристики наведені у таблиці 12.

Таблиця 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.001	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	H
Z1.002	H	H	H	B1	Cl	Cl	H	H	H
Z1.003	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1.004	H	H	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z1.005	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.006	H	H	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1.007	H	H	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z1.008	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.009	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z1.010	H	H	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z1.011	H	H	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z1.012	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl

Таблиця 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.013	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Z1.014	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z1.015	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z1.016	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Z1.017	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-i-Pr	H	Cl
Z1.018	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z1.019	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z1.020	H	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl
Z1.021	H	H	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z1.022	H	H	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z1.023	H	H	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z1.024	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z1.025	H	H	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z1.026	H	H	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z1.027	H	H	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z1.028	H	H	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z1.029	H	H	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z1.030	H	H	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z1.031	H	H	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z1.032	H	H	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z1.033	H	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z1.034	H	H	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z1.035	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z1.036	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z1.037	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z1.038	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z1.039	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z1.040	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z1.041	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z1.042	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z1.043	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1.044	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1.045	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z1.046	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z1.047	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z1.048	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z1.049	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z1.050	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z1.051	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z1.052	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z1.053	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z1.054	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z1.055	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z1.056	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z1.057	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1.058	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1.059	H	H	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Z1.060	H	H	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z1.061	H	H	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z1.062	H	H	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Z1.063	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z1.064	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1.065	H	H	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1.066	H	H	H	B1	Me	H	H	H	Me

Таблиця 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.067	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1.068	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.069	H	H	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z1.070	H	H	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Z1.071	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z1.072	H	H	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z1.073	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1.074	H	H	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1.075	H	H	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z1.076	H	H	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z1.077	H	H	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z1.078	H	H	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Z1.079	H	H	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z1.080	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z1.081	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z1.082	H	H	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z1.083	H	H	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z1.084	H	H	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z1.085	H	H	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z1.086	H	H	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z1.087	H	H	H	B1	t-Bu	H	Br	H	t-Bu
Z1.088	H	H	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z1.089	H	H	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z1.090	H	H	H	B1	t-Bu	H	OMe	H	t-Bu
Z1.091	H	H	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1.092	H	H	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.093	H	H	H	B1	F	H	H	H	F
Z1.094	H	H	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z1.095	H	H	H	B1	F	H	Br	H	F
Z1.096	H	H	H	B1	I	H	H	H	I
Z1.097	H	H	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z1.098	H	Me	H	B1	H	H	COMe	H	H
Z1.099	H	Me	H	B1	H	F	H	F	H
Z1.100	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	H
Z1.101	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1.102	H	Me	H	B1	H	t-Bu	H	t-Bu	H
Z1.103	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1.104	H	Me	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z1.105	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.106	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1.107	H	Me	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z1.108	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.109	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z1.110	H	Me	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z1.111	H	Me	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z1.112	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Z1.113	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Z1.114	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z1.115	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z1.116	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Z1.117	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-C-i-Pr	H	Cl
Z1.118	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z1.119	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z1.120	H	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl

Таблица 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.121	H	Me	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z1.122	H	Me	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z1.123	H	Me	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z1.124	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z1.125	H	Me	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z1.126	H	Me	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z1.127	H	Me	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z1.128	H	Me	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z1.129	H	Me	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z1.130	H	Me	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z1.131	H	Me	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z1.132	H	Me	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z1.133	H	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z1.134	H	Me	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z1.135	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z1.136	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z1.137	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z1.138	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z1.139	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z1.140	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z1.141	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z1.142	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z1.143	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1.144	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1.145	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z1.146	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z1.147	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z1.148	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z1.149	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z1.150	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z1.151	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z1.152	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z1.153	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z1.154	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z1.155	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z1.156	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z1.157	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1.158	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1.159	H	Me	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Z1.160	H	Me	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z1.161	H	Me	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z1.162	H	Me	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Z1.163	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z1.164	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1.165	H	Me	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1.166	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.167	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1.168	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.169	H	Me	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z1.170	H	Me	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Z1.171	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z1.172	H	Me	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z1.173	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1.174	H	Me	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me

Таблиця 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.175	H	Me	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z1.176	H	Me	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z1.177	H	Me	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z1.178	H	Me	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Z1.179	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z1.180	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z1.181	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z1.182	H	Me	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z1.183	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z1.184	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z1.185	H	Me	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z1.186	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z1.187	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z1.188	H	Me	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z1.189	H	Me	H	B1	t-Bu	H	п-Cl-феніл	H	t-Bu
Z1.190	H	Me	H	B1	H	H	CF ₃	H	H
Z1.191	H	Me	H	B1	H	H	Br	H	H
Z1.192	H	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1.193	H	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.194	H	Me	H	B1	F	H	H	H	F
Z1.195	H	Me	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z1.196	H	Me	H	B1	F	H	Br	H	F
Z1.197	H	Me	H	B1	I	H	H	H	I
Z1.198	H	Me	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z1.199	H	Me	H	B1	I	H	Br	H	I
Z1.200	H	Me	H	B1	I	H	I	H	I
Z1.201	H	Me	Me	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.202	H	Me	Me	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.203	H	Me	Me	B1	Br	H	H	H	Br
Z1.204	H	Me	Me	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.205	H	Me	Me	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.206	H	Me	Me	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1.207	H	Me	Me	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.208	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.209	Me	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.210	Me	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1.211	Me	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.212	Me	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1.213	Me	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.214	i-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.215	c-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.216	Et	Et	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.217	Et	Et	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.218	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	H
Z1.219	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1.220	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1.221	CH ₂ CH ₂		H	B1	H	H	Cl	H	H
Z1.222	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1.223	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.224	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.225	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1.226	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.227	H	CH ₂		B1	Me	H	H	H	Me
Z1.228	H	CH ₂		B1	Me	H	Br	H	Me

Таблица 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.229	H	CH ₂		B1	H	H	Cl	H	H
Z1.230	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1.231	H	CH ₂		B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1.232	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1.233	H	CH ₂		B1	Br	H	H	H	Br
Z1.234	H	CH ₂		B1	Br	H	Br	H	Br
Z1.235	H	H	H	B2	Cl	H	Cl	H	-
Z1.236	H	H	H	B2	Cl	H	Br	H	-
Z1.237	H	H	H	B2	Br	H	Br	H	-
Z1.238	H	H	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.239	H	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.240	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.241	Me	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.242	H	H	Me	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.243	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.244		CH ₂ CH ₂	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.245	H	CH ₂		B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1.246	H	H	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z1.247	H	H	H	B3	Cl	H	H	Br	-
Z1.248	H	H	H	B3	Cl	H	H	I	-
Z1.249	H	H	H	B3	Cl	H	H	Me	-
Z1.250	H	H	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z1.251	H	H	H	B3	Me	H	H	Br	-
Z1.252	H	H	H	B3	Me	H	H	Me	-
Z1.253	H	Me	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z1.254	H	Me	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z1.255	H	H	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z1.256	H	H	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z1.247	H	H	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z1.258	H	Me	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z1.259	H	Me	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z1.260	H	Me	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z1.261	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1.262	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1.263	H	H	H	B5	H	Me	H	-	-
Z1.264	H	H	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z1.265	H	H	H	B5	H	Br	H	-	-
Z1.266	H	H	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z1.267	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1.268	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1.269	H	Me	H	B5	H	Me	H	-	-
Z1.270	H	Me	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z1.271	H	Me	H	B5	H	Br	H	-	-
Z1.272	H	Me	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z1.273	H	H	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z1.274	H	H	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Z1.275	H	H	H	B20	Br	H	H	H	H
Z1.276	H	H	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z1.277	H	H	H	B20	Me	H	H	H	H
Z1.278	H	H	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Z1.279	H	H	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z1.280	H	H	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z1.281	H	Me	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z1.282	H	Me	H	B20	Cl	H	Cl	H	H

Таблица 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.283	H	Me	H	B20	Br	H	H	H	H
Z1.284	H	Me	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z1.285	H	Me	H	B20	Me	H	H	H	H
Z1.286	H	Me	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Z1.287	H	Me	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z1.288	H	Me	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z1.289	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1.290	H	H	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z1.291	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z1.292	H	H	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z1.293	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1.294	H	H	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z1.295	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z1.296	H	H	H	B21	Br	H	H	H	H
Z1.297	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z1.298	H	H	H	B21	Me	H	H	H	H
Z1.299	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1.300	H	H	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z1.301	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z1.302	H	H	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Z1.303	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1.304	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1.305	H	Me	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z1.306	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z1.307	H	Me	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z1.308	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1.309	H	Me	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z1.310	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z1.311	H	Me	H	B21	Br	H	H	H	H
Z1.312	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z1.313	H	Me	H	B21	Me	H	H	H	H
Z1.314	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1.315	H	Me	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z1.316	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z1.317	H	Me	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Z1.318	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1.319	H	H	H	B22	Me	H	H	H	H
Z1.320	H	H	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z1.321	H	H	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z1.322	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Z1.323	H	H	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z1.324	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z1.325	H	H	H	B22	H	H	H	H	Br
Z1.326	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Z1.327	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z1.328	H	H	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z1.329	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	H
Z1.330	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z1.331	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z1.332	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Z1.333	H	Me	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z1.334	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z1.335	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Br
Z1.336	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Br

Таблица 8

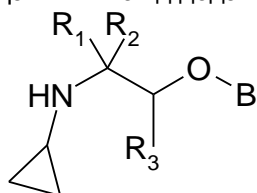
Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.337	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z1.338	H	Me	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z1.339	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z1.340	H	H	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z1.341	H	H	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z1.342	H	H	H	B23	Me	H	H	H	H
Z1.343	H	H	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z1.344	H	H	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z1.345	H	H	H	B23	H	H	H	H	Me
Z1.346	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z1.347	H	H	H	B23	Me	H	H	H	Me
Z1.348	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z1.349	H	Me	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z1.350	H	Me	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z1.351	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	H
Z1.352	H	Me	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z1.353	H	Me	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z1.354	H	Me	H	B23	H	H	H	H	Me
Z1.355	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z1.356	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	Me
Z1.357	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z1.358	H	H	H	B24	Br	H	H	H	H
Z1.359	H	H	H	B24	CN	H	H	H	H
Z1.360	H	H	H	B24	Me	H	H	H	H
Z1.361	H	H	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z1.362	H	H	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z1.363	H	H	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z1.364	H	H	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z1.365	H	H	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z1.366	H	H	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z1.367	H	H	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z1.368	H	H	H	B24	Br	H	F	H	H
Z1.369	H	H	H	B24	CN	H	F	H	H
Z1.370	H	H	H	B24	Me	H	F	H	H
Z1.371	H	H	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z1.372	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z1.373	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z1.374	H	Me	H	B24	Br	H	H	H	H
Z1.375	H	Me	H	B24	CN	H	H	H	H
Z1.376	H	Me	H	B24	Me	H	H	H	H
Z1.377	H	Me	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z1.378	H	Me	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z1.379	H	Me	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z1.380	H	Me	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z1.381	H	Me	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z1.382	H	Me	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z1.383	H	Me	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z1.384	H	Me	H	B24	Br	H	F	H	H
Z1.385	H	Me	H	B24	CN	H	F	H	H
Z1.386	H	Me	H	B24	Me	H	F	H	H
Z1.387	H	Me	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z1.388	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z1.389	H	Me	H	B25	Me	H	H	H	H
Z1.390	H	Me	H	B25	Cl	H	H	H	H

Таблиця 8

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1.391	H	Me	H	B25	OMe	H	H	H	H
Z1.392	H	Me	H	B26	Me	H	H	H	H
Z1.393	H	Me	H	B26	Cl	H	H	H	H
Z1.394	H	Me	H	B26	OMe	H	H	H	H
Z1.395	H	Me	H	B28	H	H	Me	Me	H
Z1.396	H	Me	H	B28	Me	Me	Me	Me	H
Z1.397	H	Me	H	B29	H	H	H	Me	Me
Z1.398	H	Me	H	B29	Me	Me	H	Me	Me

Таблиця 8а: Сполуки формули IIB

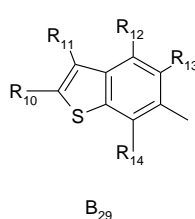
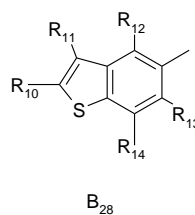
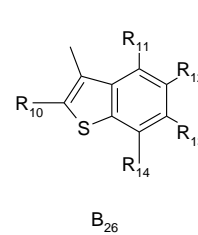
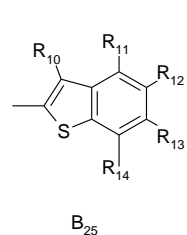
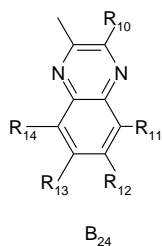
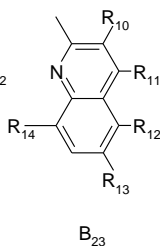
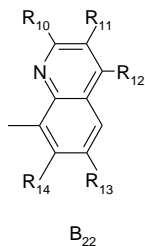
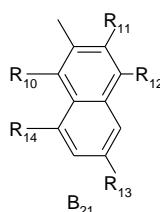
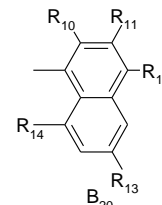
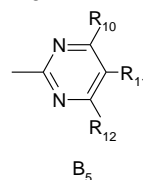
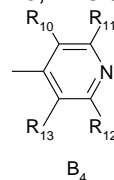
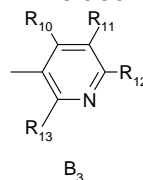
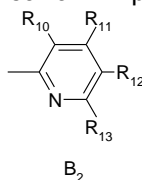
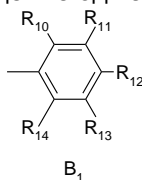
Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (IIB)



(IIB)

5

де B є однією з бажаних груп B1-B5 або B20-B26, B28 або B29



Сполуки формули (IIB) наведені нижче у таблиці 8а.

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.001	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	H
Z1a.002	H	H	H	B1	Cl	Cl	H	H	H
Z1a.003	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.004	H	H	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.005	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.006	H	H	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1a.007	H	H	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z1a.008	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.009	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z1a.010	H	H	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z1a.011	H	H	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z1a.012	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Z1a.013	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Z1a.014	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z1a.015	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z1a.016	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Z1a.017	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-i-Pr	H	Cl
Z1a.018	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z1a.019	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z1a.020	H	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl
Z1a.021	H	H	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z1a.022	H	H	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z1a.023	H	H	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z1a.024	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z1a.025	H	H	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z1a.026	H	H	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z1a.027	H	H	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z1a.028	H	H	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z1a.029	H	H	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z1a.030	H	H	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z1a.031	H	H	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z1a.032	H	H	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z1a.033	H	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z1a.034	H	H	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z1a.035	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z1a.036	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z1a.037	H	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z1a.038	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z1a.039	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z1a.040	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z1a.041	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z1a.042	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z1a.043	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1a.044	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1a.045	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z1a.046	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z1a.047	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z1a.048	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z1a.049	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z1a.050	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z1a.051	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z1a.052	H	H	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z1a.053	H	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z1a.054	H	H	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z1a.055	H	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z1a.056	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z1a.057	H	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1a.058	H	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1a.059	H	H	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Z1a.060	H	H	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z1a.061	H	H	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z1a.062	H	H	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.063	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z1a.064	H	H	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1a.065	H	H	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1a.066	H	H	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.067	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1a.068	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.069	H	H	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z1a.070	H	H	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Z1a.071	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z1a.072	H	H	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z1a.073	H	H	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1a.074	H	H	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1a.075	H	H	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z1a.076	H	H	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z1a.077	H	H	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z1a.078	H	H	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Z1a.079	H	H	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z1a.080	H	H	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z1a.081	H	H	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z1a.082	H	H	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z1a.083	H	H	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z1a.084	H	H	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z1a.085	H	H	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z1a.086	H	H	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z1a.087	H	H	H	B1	t-Bu	H	Br	H	t-Bu
Z1a.088	H	H	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z1a.089	H	H	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z1a.090	H	H	H	B1	t-Bu	H	OMe	H	t-Bu
Z1a.091	H	H	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.092	H	H	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.093	H	H	H	B1	F	H	H	H	F
Z1a.094	H	H	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z1a.095	H	H	H	B1	F	H	Br	H	F
Z1a.096	H	H	H	B1	I	H	H	H	I
Z1a.097	H	H	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z1a.098	H	Me	H	B1	H	H	COMe	H	H
Z1a.099	H	Me	H	B1	H	F	H	F	H
Z1a.100	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	H
Z1a.101	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1a.102	H	Me	H	B1	H	t-Bu	H	t-Bu	H
Z1a.103	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.104	H	Me	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.105	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.106	H	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z1a.107	H	Me	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z1a.108	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1a.109	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z1a.110	H	Me	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z1a.111	H	Me	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z1a.112	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Z1a.113	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Z1a.114	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z1a.115	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z1a.116	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.117	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-C-i-Pr	H	Cl
Z1a.118	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z1a.119	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z1a.120	H	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl
Z1a.121	H	Me	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z1a.122	H	Me	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z1a.123	H	Me	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z1a.124	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z1a.125	H	Me	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z1a.126	H	Me	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z1a.127	H	Me	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z1a.128	H	Me	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z1a.129	H	Me	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z1a.130	H	Me	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z1a.131	H	Me	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z1a.132	H	Me	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z1a.133	H	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z1a.134	H	Me	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z1a.135	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z1a.136	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z1a.137	H	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z1a.138	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z1a.139	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z1a.140	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z1a.141	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z1a.142	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z1a.143	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1a.144	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1a.145	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z1a.146	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z1a.147	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z1a.148	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z1a.149	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z1a.150	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z1a.151	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z1a.152	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z1a.153	H	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z1a.154	H	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z1a.155	H	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z1a.156	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z1a.157	H	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1a.158	H	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1a.159	H	Me	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Z1a.160	H	Me	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z1a.161	H	Me	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z1a.162	H	Me	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Z1a.163	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z1a.164	H	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z1a.165	H	Me	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z1a.166	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.167	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1a.168	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.169	H	Me	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z1a.170	H	Me	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.171	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z1a.172	H	Me	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z1a.173	H	Me	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z1a.174	H	Me	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z1a.175	H	Me	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z1a.176	H	Me	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z1a.177	H	Me	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z1a.178	H	Me	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Z1a.179	H	Me	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z1a.180	H	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z1a.181	H	Me	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z1a.182	H	Me	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z1a.183	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z1a.184	H	Me	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z1a.185	H	Me	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z1a.186	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z1a.187	H	Me	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z1a.188	H	Me	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z1a.189	H	Me	H	B1	t-Bu	H	п-Cl-феніл	H	t-Bu
Z1a.190	H	Me	H	B1	H	H	CF ₃	H	H
Z1a.191	H	Me	H	B1	H	H	Br	H	H
Z1a.192	H	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.193	H	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.194	H	Me	H	B1	F	H	H	H	F
Z1a.195	H	Me	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z1a.196	H	Me	H	B1	F	H	Br	H	F
Z1a.197	H	Me	H	B1	I	H	H	H	I
Z1a.198	H	Me	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z1a.199	H	Me	H	B1	I	H	Br	H	I
Z1a.200	H	Me	H	B1	I	H	I	H	I
Z1a.201	H	Me	Me	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.202	H	Me	Me	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1a.203	H	Me	Me	B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.204	H	Me	Me	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.205	H	Me	Me	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.206	H	Me	Me	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1a.207	H	Me	Me	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.208	H	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.209	Me	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1a.210	Me	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.211	Me	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.212	Me	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z1a.213	Me	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.214	i-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.215	c-Pr	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.216	Et	Et	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.217	Et	Et	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.218	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	H
Z1a.219	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.220	CH ₂ CH ₂		H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.221	CH ₂ CH ₂		H	B1	H	H	Cl	H	H
Z1a.222	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.223	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.224	CH ₂ CH ₂		H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.225	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.226	CH ₂ CH ₂		H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.227	H	CH ₂		B1	Me	H	H	H	Me
Z1a.228	H	CH ₂		B1	Me	H	Br	H	Me
Z1a.229	H	CH ₂		B1	H	H	Cl	H	H
Z1a.230	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.231	H	CH ₂		B1	Cl	H	H	H	Cl
Z1a.232	H	CH ₂		B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z1a.233	H	CH ₂		B1	Br	H	H	H	Br
Z1a.234	H	CH ₂		B1	Br	H	Br	H	Br
Z1a.235	H	H	H	B2	Cl	H	Cl	H	-
Z1a.236	H	H	H	B2	Cl	H	Br	H	-
Z1a.237	H	H	H	B2	Br	H	Br	H	-
Z1a.238	H	H	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.239	H	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.240	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.241	Me	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.242	H	H	Me	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.243	H	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.244	CH ₂ CH ₂		H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.245	H	CH ₂		B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z1a.246	H	H	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z1a.247	H	H	H	B3	Cl	H	H	Br	-
Z1a.248	H	H	H	B3	Cl	H	H	I	-
Z1a.249	H	H	H	B3	Cl	H	H	Me	-
Z1a.250	H	H	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z1a.251	H	H	H	B3	Me	H	H	Br	-
Z1a.252	H	H	H	B3	Me	H	H	Me	-
Z1a.253	H	Me	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z1a.254	H	Me	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z1a.255	H	H	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z1a.256	H	H	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z1a.247	H	H	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z1a.258	H	Me	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z1a.259	H	Me	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z1a.260	H	Me	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z1a.261	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1a.262	H	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1a.263	H	H	H	B5	H	Me	H	-	-
Z1a.264	H	H	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z1a.265	H	H	H	B5	H	Br	H	-	-
Z1a.266	H	H	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z1a.267	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1a.268	H	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z1a.269	H	Me	H	B5	H	Me	H	-	-
Z1a.270	H	Me	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z1a.271	H	Me	H	B5	H	Br	H	-	-
Z1a.272	H	Me	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z1a.273	H	H	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z1a.274	H	H	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.275	H	H	H	B20	Br	H	H	H	H
Z1a.276	H	H	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z1a.277	H	H	H	B20	Me	H	H	H	H
Z1a.278	H	H	H	B20	CF ₃	H	H	H	H

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.279	H	H	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z1a.280	H	H	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.281	H	Me	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z1a.282	H	Me	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.283	H	Me	H	B20	Br	H	H	H	H
Z1a.284	H	Me	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z1a.285	H	Me	H	B20	Me	H	H	H	H
Z1a.286	H	Me	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Z1a.287	H	Me	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z1a.288	H	Me	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.289	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1a.290	H	H	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z1a.291	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z1a.292	H	H	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z1a.293	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.294	H	H	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z1a.295	H	H	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z1a.296	H	H	H	B21	Br	H	H	H	H
Z1a.297	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z1a.298	H	H	H	B21	Me	H	H	H	H
Z1a.299	H	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1a.300	H	H	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z1a.301	H	H	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z1a.302	H	H	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Z1a.303	H	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.304	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1a.305	H	Me	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z1a.306	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z1a.307	H	Me	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z1a.308	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.309	H	Me	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z1a.310	H	Me	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z1a.311	H	Me	H	B21	Br	H	H	H	H
Z1a.312	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z1a.313	H	Me	H	B21	Me	H	H	H	H
Z1a.314	H	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z1a.315	H	Me	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z1a.316	H	Me	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z1a.317	H	Me	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Z1a.318	H	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z1a.319	H	H	H	B22	Me	H	H	H	H
Z1a.320	H	H	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z1a.321	H	H	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z1a.322	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Z1a.323	H	H	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z1a.324	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z1a.325	H	H	H	B22	H	H	H	H	Br
Z1a.326	H	H	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Z1a.327	H	H	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z1a.328	H	H	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z1a.329	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	H
Z1a.330	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z1a.331	H	Me	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z1a.332	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Cl

Таблиця 8а

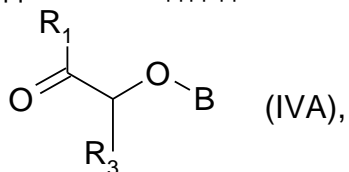
Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.333	H	Me	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z1a.334	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z1a.335	H	Me	H	B22	H	H	H	H	Br
Z1a.336	H	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Z1a.337	H	Me	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z1a.338	H	Me	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z1a.339	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z1a.340	H	H	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z1a.341	H	H	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z1a.342	H	H	H	B23	Me	H	H	H	H
Z1a.343	H	H	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z1a.344	H	H	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z1a.345	H	H	H	B23	H	H	H	H	Me
Z1a.346	H	H	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z1a.347	H	H	H	B23	Me	H	H	H	Me
Z1a.348	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z1a.349	H	Me	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z1a.350	H	Me	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z1a.351	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	H
Z1a.352	H	Me	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z1a.353	H	Me	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z1a.354	H	Me	H	B23	H	H	H	H	Me
Z1a.355	H	Me	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z1a.356	H	Me	H	B23	Me	H	H	H	Me
Z1a.357	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z1a.358	H	H	H	B24	Br	H	H	H	H
Z1a.359	H	H	H	B24	CN	H	H	H	H
Z1a.360	H	H	H	B24	Me	H	H	H	H
Z1a.361	H	H	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z1a.362	H	H	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.363	H	H	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z1a.364	H	H	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z1a.365	H	H	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z1a.366	H	H	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z1a.367	H	H	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z1a.368	H	H	H	B24	Br	H	F	H	H
Z1a.369	H	H	H	B24	CN	H	F	H	H
Z1a.370	H	H	H	B24	Me	H	F	H	H
Z1a.371	H	H	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z1a.372	H	H	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z1a.373	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z1a.374	H	Me	H	B24	Br	H	H	H	H
Z1a.375	H	Me	H	B24	CN	H	H	H	H
Z1a.376	H	Me	H	B24	Me	H	H	H	H
Z1a.377	H	Me	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z1a.378	H	Me	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z1a.379	H	Me	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z1a.380	H	Me	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z1a.381	H	Me	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z1a.382	H	Me	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z1a.383	H	Me	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z1a.384	H	Me	H	B24	Br	H	F	H	H
Z1a.385	H	Me	H	B24	CN	H	F	H	H
Z1a.386	H	Me	H	B24	Me	H	F	H	H

Таблиця 8а

Сполука №	R ₂	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z1a.387	H	Me	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z1a.388	H	Me	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z1a.389	H	Me	H	B25	Me	H	H	H	H
Z1a.390	H	Me	H	B25	Cl	H	H	H	H
Z1a.391	H	Me	H	B25	OMe	H	H	H	H
Z1a.392	H	Me	H	B26	Me	H	H	H	H
Z1a.393	H	Me	H	B26	Cl	H	H	H	H
Z1a.394	H	Me	H	B26	OMe	H	H	H	H
Z1a.395	H	Me	H	B28	H	H	Me	Me	H
Z1a.396	H	Me	H	B28	Me	Me	Me	Me	H
Z1a.397	H	Me	H	B29	H	H	H	Me	Me
Z1a.398	H	Me	H	B29	Me	Me	H	Me	Me

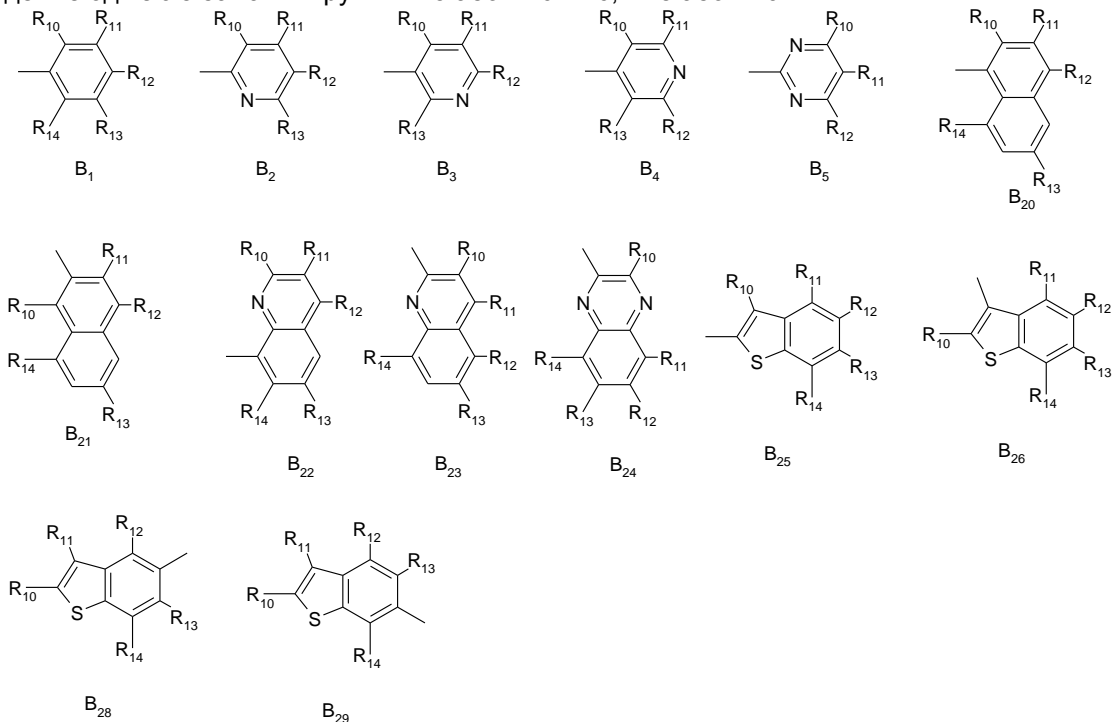
Таблиця 9 Сполуки формули IVA

Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (IVA)



5

де B є однією з бажаних груп B1-B5 або B20-B26, B28 або B29:



Сполуки формули IVA наведені нижче у таблиці 9. Характеристики наведені у таблиці 12.

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.001	H	H	B1	Cl	H	H	H	H
Z2.002	H	H	B1	Cl	Cl	H	H	H
Z2.003	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z2.004	H	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z2.005	H	H	B1	Cl	H	H	H	Cl

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.006	H	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z2.007	H	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z2.008	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z2.009	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z2.010	H	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z2.011	H	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z2.012	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Z2.013	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl
Z2.014	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z2.015	H	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z2.016	H	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Z2.017	H	H	B1	Cl	H	C≡C-i-Pr	H	Cl
Z2.018	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z2.019	H	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z2.020	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl
Z2.021	H	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z2.022	H	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z2.023	H	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z2.024	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z2.025	H	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z2.026	H	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z2.027	H	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z2.028	H	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z2.029	H	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z2.030	H	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z2.031	H	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z2.032	H	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z2.033	H	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z2.034	H	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z2.035	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z2.036	H	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z2.037	H	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z2.038	H	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z2.039	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z2.040	H	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z2.041	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z2.042	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z2.043	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z2.044	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z2.045	H	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z2.046	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z2.047	H	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z2.048	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z2.049	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z2.050	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z2.051	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z2.052	H	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z2.053	H	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z2.054	H	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z2.055	H	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z2.056	H	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z2.057	H	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z2.058	H	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z2.059	H	H	B1	OMe	H	H	H	OMe

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.060	H	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z2.061	H	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z2.062	H	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Z2.063	H	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z2.064	H	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z2.065	H	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z2.066	H	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z2.067	H	H	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z2.068	H	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z2.069	H	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z2.070	H	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Z2.071	H	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z2.072	H	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z2.073	H	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z2.074	H	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z2.075	H	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z2.076	H	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z2.077	H	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z2.078	H	H	B1	Me	H	p-Cl-феніл	H	Me
Z2.079	H	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z2.080	H	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z2.081	H	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z2.082	H	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z2.083	H	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z2.084	H	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z2.085	H	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z2.086	H	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z2.087	H	H	B1	t-Bu	H	Br	H	t-Bu
Z2.088	H	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z2.089	H	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z2.090	H	H	B1	t-Bu	H	OMe	H	t-Bu
Z2.091	H	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z2.092	H	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z2.093	H	H	B1	F	H	H	H	F
Z2.094	H	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z2.095	H	H	B1	F	H	Br	H	F
Z2.096	H	H	B1	I	H	H	H	I
Z2.097	H	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z2.098	Me	H	B1	H	H	COMe	H	H
Z2.099	Me	H	B1	H	F	H	F	H
Z2.100	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	H
Z2.101	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z2.102	Me	H	B1	H	t-Bu	H	t-Bu	H
Z2.103	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	H
Z2.104	Me	H	B1	Cl	H	H	Cl	H
Z2.105	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z2.106	Me	H	B1	H	Cl	Cl	H	H
Z2.107	Me	H	B1	H	Cl	H	Cl	H
Z2.108	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z2.109	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Cl
Z2.110	Me	H	B1	Cl	H	I	H	Cl
Z2.111	Me	H	B1	Cl	H	CHF ₂	H	Cl
Z2.112	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Cl
Z2.113	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Cl

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.114	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Me	H	Cl
Z2.115	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-Si(Me) ₃	H	Cl
Z2.116	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-t-Bu	H	Cl
Z2.117	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-C-i-Pr	H	Cl
Z2.118	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Cl
Z2.119	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-п-Cl-феніл	H	Cl
Z2.120	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-феніл	H	Cl
Z2.121	Me	H	B1	Cl	H	CHO	H	Cl
Z2.122	Me	H	B1	Cl	H	CH=NOMe	H	Cl
Z2.123	Me	H	B1	Cl	H	COMe	H	Cl
Z2.124	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Cl
Z2.125	Me	H	B1	Cl	H	NO ₂	H	Cl
Z2.126	Me	H	B1	Cl	H	NH ₂	H	Cl
Z2.127	Me	H	B1	Cl	H	NHMe	H	Cl
Z2.128	Me	H	B1	Cl	H	N(Me) ₂	H	Cl
Z2.129	Me	H	B1	Cl	H	NHCOMe	H	Cl
Z2.130	Me	H	B1	Cl	H	N=CHNEt(Me)	H	Cl
Z2.131	Me	H	B1	Cl	H	OCF ₃	H	Cl
Z2.132	Me	H	B1	Cl	H	OCH ₂ CH=CHCl ₂	H	Cl
Z2.133	Me	H	B1	Cl	H	п-Cl-фенокси	H	Cl
Z2.134	Me	H	B1	Cl	Me	Cl	H	Cl
Z2.135	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	H	Cl
Z2.136	Me	H	B1	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Z2.137	Me	H	B1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
Z2.138	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Me
Z2.139	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	Me
Z2.140	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	Me
Z2.141	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	Me
Z2.142	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	Me
Z2.143	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z2.144	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z2.145	Me	H	B1	Cl	H	H	H	CHO
Z2.146	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	CHO
Z2.147	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	CHO
Z2.148	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	CHO
Z2.149	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	CHO
Z2.150	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	CHO
Z2.151	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	CHO
Z2.152	Me	H	B1	Cl	H	H	H	OMe
Z2.153	Me	H	B1	Cl	H	Cl	H	OMe
Z2.154	Me	H	B1	Cl	H	Br	H	OMe
Z2.155	Me	H	B1	Cl	H	CF ₃	H	OMe
Z2.156	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-H	H	OMe
Z2.157	Me	H	B1	Cl	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z2.158	Me	H	B1	Cl	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z2.159	Me	H	B1	OMe	H	H	H	OMe
Z2.160	Me	H	B1	OMe	H	Cl	H	OMe
Z2.161	Me	H	B1	OMe	H	Br	H	OMe
Z2.162	Me	H	B1	OMe	H	CF ₃	H	OMe
Z2.163	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-H	H	OMe
Z2.164	Me	H	B1	OMe	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	OMe
Z2.165	Me	H	B1	OMe	H	C(Me)=NOMe	H	OMe
Z2.166	Me	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z2.167	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	Me

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.168	Me	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z2.169	Me	H	B1	Me	H	I	H	Me
Z2.170	Me	H	B1	Me	H	CF ₃	H	Me
Z2.171	Me	H	B1	Me	H	C≡C-H	H	Me
Z2.172	Me	H	B1	Me	H	Me	H	Me
Z2.173	Me	H	B1	Me	H	C≡C-CH ₂ OMe	H	Me
Z2.174	Me	H	B1	Me	H	C(Me)=NOMe	H	Me
Z2.175	Me	H	B1	Me	H	NO ₂	H	Me
Z2.176	Me	H	B1	Me	H	NH ₂	H	Me
Z2.177	Me	H	B1	Me	H	NHCOMe	H	Me
Z2.178	Me	H	B1	Me	H	п-Cl-феніл	H	Me
Z2.179	Me	H	B1	Me	H	H	H	CHO
Z2.180	Me	H	B1	Me	H	Cl	H	CHO
Z2.181	Me	H	B1	Me	H	Br	H	CHO
Z2.182	Me	H	B1	i-Pr	H	H	H	i-Pr
Z2.183	Me	H	B1	i-Pr	H	Cl	H	i-Pr
Z2.184	Me	H	B1	i-Pr	H	Br	H	i-Pr
Z2.185	Me	H	B1	t-Bu	H	H	H	t-Bu
Z2.186	Me	H	B1	t-Bu	H	Cl	H	t-Bu
Z2.187	Me	H	B1	t-Bu	H	Me	H	t-Bu
Z2.188	Me	H	B1	t-Bu	H	t-Bu	H	t-Bu
Z2.189	Me	H	B1	t-Bu	H	п-Cl-феніл	H	t-Bu
Z2.190	Me	H	B1	H	H	CF ₃	H	H
Z2.191	Me	H	B1	H	H	Br	H	H
Z2.192	Me	H	B1	Br	H	H	H	Br
Z2.193	Me	H	B1	Br	H	Br	H	Br
Z2.194	Me	H	B1	F	H	H	H	F
Z2.195	Me	H	B1	F	H	Cl	H	F
Z2.196	Me	H	B1	F	H	Br	H	F
Z2.197	Me	H	B1	I	H	H	H	I
Z2.198	Me	H	B1	I	H	Cl	H	I
Z2.199	Me	H	B1	I	H	Br	H	I
Z2.200	Me	H	B1	I	H	I	H	I
Z2.201	Me	Me	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z2.202	Me	Me	B1	Cl	H	Cl	H	Cl
Z2.203	Me	Me	B1	Br	H	H	H	Br
Z2.204	Me	Me	B1	Br	H	Br	H	Br
Z2.205	Me	Me	B1	Me	H	H	H	Me
Z2.206	Me	Me	B1	Me	H	Cl	H	Me
Z2.207	Me	Me	B1	Me	H	Br	H	Me
Z2.208	Me	H	B1	Cl	H	H	H	Cl
Z2.209	Et	H	B1	Me	H	H	H	Me
Z2.210	Et	H	B1	Me	H	Br	H	Me
Z2.211	H	H	B2	Cl	H	Cl	H	-
Z2.212	H	H	B2	Cl	H	Br	H	-
Z2.213	H	H	B2	Br	H	Br	H	-
Z2.214	H	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z2.215	Me	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z2.216	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z2.217	H	Me	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z2.218	Et	H	B2	Cl	H	CF ₃	H	-
Z2.219	H	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z2.220	H	H	B3	Cl	H	H	Br	-
Z2.221	H	H	B3	Cl	H	H	I	-

Таблица 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.222	H	H	B3	Cl	H	H	Me	-
Z2.223	H	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z2.224	H	H	B3	Me	H	H	Br	-
Z2.225	H	H	B3	Me	H	H	Me	-
Z2.226	Me	H	B3	Cl	H	H	Cl	-
Z2.227	Me	H	B3	Me	H	H	Cl	-
Z2.228	H	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z2.229	H	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z2.230	H	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z2.231	Me	H	B4	Cl	H	H	Cl	-
Z2.232	Me	H	B4	Br	H	H	Br	-
Z2.233	Me	H	B4	Me	H	H	Me	-
Z2.234	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z2.235	H	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z2.236	H	H	B5	H	Me	H	-	-
Z2.237	H	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z2.238	H	H	B5	H	Br	H	-	-
Z2.239	H	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z2.240	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z2.241	Me	H	B5	Me	H	Me	-	-
Z2.242	Me	H	B5	H	Me	H	-	-
Z2.243	Me	H	B5	H	Cl	H	-	-
Z2.244	Me	H	B5	H	Br	H	-	-
Z2.245	Me	H	B5	H	CF ₃	H	-	-
Z2.246	H	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z2.247	H	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Z2.248	H	H	B20	Br	H	H	H	H
Z2.249	H	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z2.250	H	H	B20	Me	H	H	H	H
Z2.251	H	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Z2.252	H	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z2.253	H	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z2.254	Me	H	B20	Cl	H	H	H	H
Z2.255	Me	H	B20	Cl	H	Cl	H	H
Z2.256	Me	H	B20	Br	H	H	H	H
Z2.257	Me	H	B20	Br	H	Br	H	H
Z2.258	Me	H	B20	Me	H	H	H	H
Z2.259	Me	H	B20	CF ₃	H	H	H	H
Z2.260	Me	H	B20	COMe	H	H	H	H
Z2.261	Me	H	B20	Cl	H	H	Cl	H
Z2.262	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z2.263	H	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z2.264	H	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z2.265	H	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z2.266	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z2.267	H	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z2.268	H	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z2.269	H	H	B21	Br	H	H	H	H
Z2.270	H	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z2.271	H	H	B21	Me	H	H	H	H
Z2.272	H	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z2.273	H	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z2.274	H	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z2.275	H	H	B21	Me	H	H	Cl	H

Таблиця 9

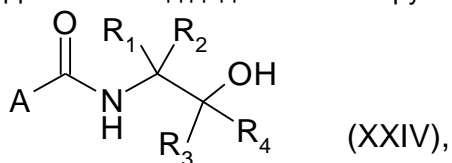
Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.276	H	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z2.277	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z2.278	Me	H	B21	H	Cl	H	H	H
Z2.279	Me	H	B21	Cl	Cl	H	H	H
Z2.280	Me	H	B21	H	H	H	Cl	H
Z2.281	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z2.282	Me	H	B21	H	Cl	H	Cl	H
Z2.283	Me	H	B21	Cl	Cl	H	Cl	H
Z2.284	Me	H	B21	Br	H	H	H	H
Z2.285	Me	H	B21	CF ₃	H	H	H	H
Z2.286	Me	H	B21	Me	H	H	H	H
Z2.287	Me	H	B21	Cl	H	H	H	H
Z2.288	Me	H	B21	Br	H	H	Cl	H
Z2.289	Me	H	B21	CF ₃	H	H	Cl	H
Z2.290	Me	H	B21	Me	H	H	Cl	H
Z2.291	Me	H	B21	Cl	H	H	Cl	H
Z2.292	H	H	B22	Me	H	H	H	H
Z2.293	H	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z2.294	H	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z2.295	H	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Z2.296	H	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z2.297	H	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z2.298	H	H	B22	H	H	H	H	Br
Z2.299	H	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Z2.300	H	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z2.301	H	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z2.302	Me	H	B22	Me	H	H	H	H
Z2.303	Me	H	B22	H	H	H	H	Cl
Z2.304	Me	H	B22	Me	H	H	H	Cl
Z2.305	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Cl
Z2.306	Me	H	B22	H	H	H	NO ₂	Cl
Z2.307	Me	H	B22	H	H	H	Me	Cl
Z2.308	Me	H	B22	H	H	H	H	Br
Z2.309	Me	H	B22	H	H	H	Cl	Br
Z2.310	Me	H	B22	H	H	H	Me	Br
Z2.311	Me	H	B22	H	H	H	Br	Br
Z2.312	H	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z2.313	H	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z2.314	H	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z2.315	H	H	B23	Me	H	H	H	H
Z2.316	H	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z2.317	H	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z2.318	H	H	B23	H	H	H	H	Me
Z2.319	H	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z2.320	H	H	B23	Me	H	H	H	Me
Z2.321	Me	H	B23	Cl	H	H	H	H
Z2.322	Me	H	B23	Cl	Cl	H	H	H
Z2.323	Me	H	B23	Cl	Me	H	H	H
Z2.324	Me	H	B23	Me	H	H	H	H
Z2.325	Me	H	B23	Me	Cl	H	H	H
Z2.326	Me	H	B23	Me	Me	H	H	H
Z2.327	Me	H	B23	H	H	H	H	Me
Z2.328	Me	H	B23	Cl	H	H	H	Me
Z2.329	Me	H	B23	Me	H	H	H	Me

Таблиця 9

Сполука №	R ₁	R ₃	B	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	R ₁₃	R ₁₄
Z2.330	H	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z2.331	H	H	B24	Br	H	H	H	H
Z2.332	H	H	B24	CN	H	H	H	H
Z2.333	H	H	B24	Me	H	H	H	H
Z2.334	H	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z2.335	H	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z2.336	H	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z2.337	H	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z2.338	H	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z2.339	H	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z2.340	H	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z2.341	H	H	B24	Br	H	F	H	H
Z2.342	H	H	B24	CN	H	F	H	H
Z2.343	H	H	B24	Me	H	F	H	H
Z2.344	H	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z2.345	H	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z2.346	Me	H	B24	Cl	H	H	H	H
Z2.347	Me	H	B24	Br	H	H	H	H
Z2.348	Me	H	B24	CN	H	H	H	H
Z2.349	Me	H	B24	Me	H	H	H	H
Z2.350	Me	H	B24	OMe	H	H	H	H
Z2.351	Me	H	B24	Cl	H	Cl	H	H
Z2.352	Me	H	B24	Br	H	Cl	H	H
Z2.353	Me	H	B24	CN	H	Cl	H	H
Z2.354	Me	H	B24	Me	H	Cl	H	H
Z2.355	Me	H	B24	OMe	H	Cl	H	H
Z2.356	Me	H	B24	Cl	H	F	H	H
Z2.357	Me	H	B24	Br	H	F	H	H
Z2.358	Me	H	B24	CN	H	F	H	H
Z2.359	Me	H	B24	Me	H	F	H	H
Z2.360	Me	H	B24	OMe	H	F	H	H
Z2.361	Me	H	B24	Cl	H	H	H	F
Z2.361	Me	H	B25	Me	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B25	Cl	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B25	OMe	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B26	Me	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B26	Cl	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B26	OMe	H	H	H	H
Z2.361	Me	H	B28	H	H	Me	Me	H
Z2.361	Me	H	B28	Me	Me	Me	Me	H
Z2.361	Me	H	B29	H	H	H	Me	Me
Z2.361	Me	H	B29	Me	Me	H	Me	Me

Таблиця 10 Сполуки формули XXIV:

Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (XXIV)



5

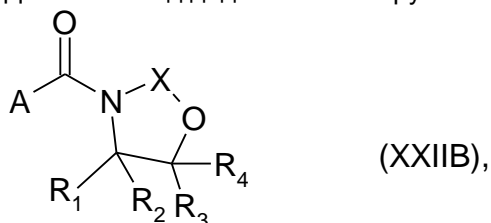
які наведені нижче у таблиці 10. Характеристики наведені у таблиці 12.

Таблиця 10

Сполука №	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	A
Z3.1	H	H	H	H	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.2	Me	H	H	H	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.3	H	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.4	Me	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.5	H	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.6	Me	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.7	H	H	H	H	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.8	Me	H	H	H	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.9	H	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.10	Me	H	H	H	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.11	H	H	H	H	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.12	Me	H	H	H	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.13	H	H	H	H	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.14	Me	H	H	H	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл

Таблиця 11: Сполуки формули XXIIВ

Даний винахід додатково ілюструється бажаними окремими сполуками формули (XXIIВ)



5

які наведені нижче у таблиці 11. Характеристики наведені у таблиці 12.

Таблиця 11

Сполука №	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X	A
Z3.1	H	H	H	H	-SO-	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.2	Me	H	H	H	-SO-	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.3	H	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.4	Me	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.5	H	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.6	Me	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.7	H	H	H	H	-SO-	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.8	Me	H	H	H	-SO-	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.9	H	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.10	Me	H	H	H	-SO-	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.11	H	H	H	H	-SO-	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.12	Me	H	H	H	-SO-	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.13	H	H	H	H	-SO-	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.14	Me	H	H	H	-SO-	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.15	H	H	H	H	-SO ₂ -	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.16	Me	H	H	H	-SO ₂ -	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.17	H	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.18	Me	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл
Z3.19	H	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.20	Me	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-пірол-4-іл
Z3.21	H	H	H	H	-SO ₂ -	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.22	Me	H	H	H	-SO ₂ -	3-дифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.23	H	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.24	Me	H	H	H	-SO ₂ -	3-трифторметил-1-метил-1H-триазол-4-іл
Z3.25	H	H	H	H	-SO ₂ -	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл

Таблиця 11

Сполука №	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X	A
Z3.26	Me	H	H	H	-SO ₂ -	4-дифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.27	H	H	H	H	-SO ₂ -	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл
Z3.28	Me	H	H	H	-SO ₂ -	4-трифторметил-2-метилтіазол-5-іл

Таблиця 12: Характеристики

У таблиці 12 наведені деякі температури плавлення і деякі дані ЯМР для сполук, представлених у таблицях 1-11. для досліджень за допомогою ЯМР використовували CDCl₃, якщо не зазначене інше. Якщо міститься суміш розчинників, то вона описується, наприклад, як: CDCl₃/d₆-ДМСО). Не було зроблено спроб навести всі характеристики сполук для всіх випадків. Дані РХМС, що містять фізико-хімічний опис, одержані на аналітичному приладі Waters LC-MS (W2790, ZMD-2000). Використана колонка Atlantis dC18, 3 мкм 3,0 мм×20 мм. Використані розчинники: А=0,1 % водний розчин мурашиної кислоти, В=0,1 % розчин мурашиної кислоти в ацетонітрилі. Використаний градієнтний режим від 10 % до 90 % В протягом 2,9 хв; швидкість потоку складала 1,7 мл/хв. наступні фізико-хімічні характеристики: час утримання (хв); М визначали в режимі позитивної іонізації (m/z⁺).

У таблиці 12 і у всьому наведеному нижче описі температури наведені у градусах Цельсія; "ЯМР" означає спектр ядерного магнітного резонансу; МС означає мас-спектр; і "%" означає мас. %, якщо відповідні концентрації не наведені в інших одиницях виміру. У всьому даному описі використовуються наведені нижче аббревіатури:

т. пл. =	температура плавлення	т. кип. =	температура кипіння
s =	синглет	br =	широкий
d =	дублет	dd =	дублет дублетів
t =	триплет	q =	квартет
m =	мультиплет	част./млн =	частин на мільйон

Таблиця 12

Сполука №	Дані ¹ H-ЯМР: част./млн (мультиплетність/кількість H).	МС [M+H] ⁺	т. пл. (°C)	Дані РХМС
1.098	1,40(d, 3H, CH ₃), 2,53(s, 3H, CH ₃), 3,90(s, 3H, CH ₃), 4,05-4,12(m, 2H, CH ₂), 4,52-4,57(m, 1H, CH), 6,68(m _{широкий} , 1H, NH), 6,71-6,98(t, 1H, CHF ₂), 6,94-6,97(d, 2H, Ar-H), 7,90-7,94(m, 3H, 2H-Ar+1H, піразол-H).	352	смола	-
1.099	-	-	-	1,34 хв; 346
1.100	-	-	-	1,57 хв; 358
1.101	-	-	-	1,59 хв; 378
1.102	-	-	-	2,13 хв; 422
1.103	-	-	-	1,51 хв; 378
1.104 (S)-енантіомер				1,42 хв; 378
1.108	1,46-1,48(d, 3H), 3,93(s, 3H), 4,02-4,12(ddd, 2H), 4,49-4,55(m, 1H), 6,68(s, 1H) 6,76-7,03 (t, 1H), 7,31(s, 2H), 7,88(s, 1H).	412,6/414,5/416,5	124-126	-
1.121 (S)-енантіомер				1,30 хв; 406
1.125 (S)-енантіомер				1,72 хв; 423
1.132 (S)-енантіомер				1,88 хв; 502
1.137 (S)-енантіомер				1,87 хв; 479

Таблиця 12

Сполука №	Дані ^1H -ЯМР: част./млн (мультиплетність/кількість Н).	МС $[\text{M}+\text{H}]^+$	т. пл. ($^{\circ}\text{C}$)	Дані РХМС
1.140 (S)- енантіомер				1,64 хв; 436
1.166	1,46-1,48(d, 3H), 2,21(2s, 6H), 3,77-3,87(ddd, 2H), 3,94(s, 3H), 4,47-4,53(m, 1H), 6,76-7,03(t, 1H), 6,79(s, 1H), 6,91(d, 1H), 7,00(d, 2H), 7,93(s, 1H).	338	142-146	-
1.168	1,44-1,46(d, 3H), 2,21(2s, 6H), 3,72-3,85(ddd, 2H), 3,89(s, 3H), 4,46-4,51(m, 1H), 6,76(s, 1H), 6,77-7,03(t, 1H), 7,11(s, 1H), 7,93(s, 1H).	416/418	119-121	-
1.172 (S)- енантіомер				1,52 хв; 352
1.180 (S)- енантіомер				1,39 хв; 386
1.182 (S)- енантіомер				1,80 хв; 394
1.185 (S)- енантіомер				2,02 хв; 422
1.187 (S)- енантіомер				2,08 хв; 436
1.188 (S)- енантіомер				2,31 хв; 478
1.190	1,39-1,41(d, 3H), 3,91(s, 3H), 4,03-4,10(ddd, 2H), 4,51-4,57(m, 1H), 6,63(s, 1H) 6,66-7,93 (t, 1H), 6,98(d, 2H), 7,53-7,55(d, 2H) 7,91(s, 1H).	378,6/379,7	99-102	-
1.191	1,30-1,32(d, 3H), 3,85(s, 3H), 3,89-3,95(ddd, 2H), 4,42-4,46(m, 1H), 6,59(s, 1H) 6,73-6,86 (t, 1H), 6,74(d, 2H), 7,29-7,31(d, 2H), 7,84(s, 1H).	388/390	106-108	-
1.193	1,48-1,50(d, 3H), 3,93(s, 3H), 4,02-4,10(ddd, 2H), 4,52-4,55(m, 1H), 6,67(s, 1H) 6,78-7,05 (t, 1H), 7,64(s, 2H), 7,88(s, 1H).	543,8/545,7/549,8	122-124	-
1.194 (S)- енантіомер	-	-	-	1,20 хв; 346
1.221	-	-	-	1,32 хв; 356
1.239	1,39-1,41(d, 3H, CH_3), 3,91(s, 3H, CH_3), 4,46-4,54(m, 2H, CH_2), 4,60-4,66(m, 1H, CH), 6,63(s, 1H, NH), 6,67-6,81(t, 1H, CHF_2), 7,85(d, 1H, Py-H), 7,90(s, 1H, піразол-Н), 8,30(t, 1H, Py-H).	413/415	115-118	-
1.565			88-90	
1.649			110-114	
1.650			113-116	
1.651			108-111	
2.218	-	-	-	2,00 хв; 374
2.565			121-123	
2.649			130-132	
2.651			смола	
3.649			134-136	
4.565			109-110	
4.649			151-153	

Таблиця 12

Сполука №	Дані ^1H -ЯМР: част./млн (мультиплетність/кількість Н).	МС $[\text{M}+\text{H}]^+$	т. пл. ($^{\circ}\text{C}$)	Дані РХМС
5.565		534	смола	
5.649			90-92	
5.651			смола	
Z1.108 вільна основа	-	254,5/256,5/258,5	воскоподібна тверда речовина	-
Z1.166 (S)- енантіомер сіль з HCl	-		190-193	
Z1.190 вільна основа	-	220,1	воскоподібна тверда речовина	-
Z1.191 вільна основа	-	230/232	воскоподібна тверда речовина	-
Z1.193 вільна основа	-	389,8/391,8	воскоподібна тверда речовина	-

Приклади препаратів сполук формули I:

Приклади F-1.1-F-1.2: Емульгувальні концентрати

Компоненти	F-1.1	F-1.2
Сполука таблиць 1-7 (1a-7a)	25 %	50 %
Додецилбензолсульфонат кальцію	5 %	6 %
Полігліколевий ефір касторової олії (36 молей етиленоксидних ланок)	5 %	-
Простий ефір трибутилфеноксиполіетиленгліколю (30 молей етиленоксидних ланок)	-	4 %
Циклогексанон	-	20 %
Суміш ксилолів	65 %	20 %

5

З цих концентратів шляхом розведення водою можна одержати емульсії будь-якої необхідної концентрації.

Приклад F-2: Емульгувальний концентрат

Компоненти	F-2
Сполука таблиць 1-7 (1a-7a)	10 %
Октилфенолполіетиленгліколевий ефір (4-5 молей етиленоксидних ланок)	3 %
Додецилбензолсульфонат кальцію	3 %
Полігліколевий ефір касторової олії (36 молей етиленоксидних ланок)	4 %
Циклогексанон	30 %
Суміш ксилолів	50 %

10

З цього концентрату шляхом розведення водою можна одержати емульсії будь-якої необхідної концентрації.

Приклади F-3.1-F-3.4: Розчини

Компоненти	F-3.1	F-3.2	F-3.3	F-3.4
Сполука таблиц 1-7 (1а-7а)	80 %	10 %	5 %	95 %
Монометилловий ефір етиленгліколю	20 %	-	-	-
Поліетиленгліколь з молекулярною масою 400	-	-	70 %	-
N-Метилпіролід-2-он	-	20 %	-	-
Епоксидована кокосова олія	-	-	1 %	5 %
Петролейний ефір (діапазон температур кипіння: 160-190 °C)	-	-	94 %	-

Ці розчини придатні для застосування у вигляді мікрокрапельок.

Приклади F-4.1-F-4.4: Грануляти

5

Компоненти	F-4.1	F-4.2	F-4.3	F-4.4
Сполука таблиц 1-7 (1а-7а)	5 %	10 %	8 %	21 %
Каолін	94 %	-	79 %	54 %
Високодиспергований діоксид кремнію	1 %	-	13 %	7 %
Атапульгіт	-	90 %	-	18 %

Нові сполуки розчиняють у дихлорметані, розчин розбризкують на носій і потім розчинник видаляють шляхом відгонки у вакуумі.

Приклади F-5.1 і F-5.2: Дусти

10

Компоненти	F-5.1	F-5.2
Сполука таблиц 1-7 (1а-7а)	2 %	5 %
Високодиспергований діоксид кремнію	1 %	5 %
Тальк	97 %	-
Каолін	-	90 %

Готові для застосування дусти одержують ретельно змішуванням всіх компонентів.

Приклади F-6.1-F-6.3: Змочувальні порошки

Компоненти	F-6.1	F-6.2	F-6.3
Сполука таблиц 1-7 (1а-7а)	25 %	50 %	75 %
Лігносульфонат натрію	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрію	3 %	-	5 %
Діізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6 %	10 %
Фенолполіетиленгліколевий ефір (7-8 молей етиленоксидних ланок)	-	2 %	-
Високодиспергована кремнієва кислота	5 %	10 %	10 %
Каолін	62 %	27 %	-

15

Всі компоненти змішують і суміш ретельно розмелюють на придатному млині і одержують змочувальні порошки, які можна розбавити водою і одержати суспензії необхідної концентрації.

Приклад F7: Текучий концентрат для обробки насіння

Сполука таблиц 1-7 (1а-7а)	40 %
Пропіленгліколь	5 %
Співполімер бутанол ПО/ЕО*	2 %
Тристирилфенол з 10-20 моль ЕО	2 %
1,2-Бензотіазолін-3-он (у вигляді 20 % водного розчину)	0,5 %
Кальцієва сіль моноазопігменту	5 %
Силіконове масло (у вигляді 75 % емульсії у воді)	0,2 %
Вода	45,3 %

20

*Пропіленоксид/етиленоксид

Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують з допоміжними речовинами і одержують концентрат суспензії, з якого шляхом розведення водою можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення. За допомогою таких розведених систем живі рослини, а

також матеріал для розмноження рослин можна обробити і захистити від зараження мікроорганізмами шляхом обприскування, поливу або занурення.

Біологічні приклади: фунгіцидний вплив

Приклад В-1: Вплив на *Botrytis cinerea* – дослідження росту грибів

Конідії грибів, що взяті з криогенного сховища, безпосередньо змішують з живильним бульйоном (картопляно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (в ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають у планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення зростання визначають фотометрично через 3-4 дні. Активність сполуки виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутнє придушення зростання, значення, що дорівнюють від 80 % до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

У цьому дослідженні сполуки 1.101, 1.166 і 1.193 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполуки 1.221 і 1.239 виявляють гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-2: Вплив на *Mycosphaerella arachidis* (церкоспороз арахісу; *Cercospora arachidicola* [анаморфа]) – дослідження росту грибів

Конідії грибів, що взяті з криогенного сховища, безпосередньо змішують з живильним бульйоном (картопляно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (в ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають у планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення зростання визначають фотометрично через 6-7 днів. Активність сполуки виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутнє придушення зростання, значення, що дорівнюють від 80 % до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

У цьому дослідженні сполуки 1.101, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193, 1.221 і 1.239 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполуки 1.100, 1.102 і 1.103 виявляють гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-3: Вплив на *Septoria tritici* – дослідження росту грибів

Конідії грибів, що взяті з криогенного сховища, безпосередньо змішують з живильним бульйоном (картопляно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (в ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають в планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають живильний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення зростання визначають фотометрично через 72 год. Активність сполуки виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутнє придушення зростання, значення, що дорівнюють 80 % до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

У цьому дослідженні сполуки 1.099, 1.101, 1.103, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193, 1.221 і 1.239 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполука 1.102 виявляє гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-4: Вплив на *Tapesia yallundae* – дослідження росту грибів

Конідії грибів, що взяті з криогенного сховища, безпосередньо змішують з живильним бульйоном (картопляно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (в ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають в планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають живильний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення зростання визначають фотометрично через 6-7 днів. Активність сполуки виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутнє придушення зростання, значення, що дорівнюють 80 % до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

У цьому дослідженні сполуки 1.101 і 1.102 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

Приклад В-5: Вплив на *Monographella nivalis* (анаморфа: *Fusarium nivale*, *Microdochium nivale*; сніжна пліснява) – дослідження росту грибів

Конідії грибів, що взяті з криогенного сховища, безпосередньо змішують з живильним бульйоном (картопляно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (в ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають в планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають живильний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення зростання визначають фотометрично через 6-7 днів. Активність сполуки виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутнє придушення зростання, значення, що

дорівнюють 80 % до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

У цьому дослідженні сполуки 1.101, 1.102, 1.103, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193 і 1.221 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

5 У цьому дослідженні сполуки 1.099 і 1.239 виявляють гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-6: Вплив на *Rhizoctonia solani* – дослідження росту грибів. Фрагменти міцелію грибів, приготовлені зі свіжевирощеної рідкої культури, безпосередньо змішують із живильним бульйоном (картофельно-декстрозний бульйон, КДБ). Розчини (у ДМСО) досліджуваних сполук (0,002 % активного інгредієнта) поміщають у планшет для мікротитрування (96-ямковий) і додають живильний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубують при 24 °C і придушення росту визначають фотометрично через 3-4 дні. Активність сполук виражають, як придушення росту грибів (0 = відсутність придушення росту, показники від 80 до 90 % означають придушення від гарного до дуже гарного, 100 % = повне придушення).

10 У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат) і 1.193 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполука 1.101 виявляє гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-7: Вплив на *Phytophthora infestans* (картопляна гниль) на томатах

Кружечки листя томатів поміщають на водний агар у багатолункові планшети (24-ямкові) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 4 дні після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

20 У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер і 1.166 (рацемат) виявляють гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-8: Вплив на *Botrytis cinerea* (сіра гниль) на бобах

25 Кружечки листя бобів поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямковий) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 3 дні після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

30 У цьому дослідженні сполуки 1.099, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193, 1.221 і 1.239 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполука 1.101 виявляє гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-9: Вплив на *Erysiphe graminis* f.sp. *tritici* (борошниста роса пшениці)

35 Сегменти листя пшениці поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямковий) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 7 днів після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193, 1.221 і 1.239 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполука 1.103 виявляє гарну активність (придушення ≤ 50 %).

40 Приклад В-10: Захисна обробка від *Russcinea recondita* (бура іржа) на пшениці

Сегменти листя пшениці поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямковий) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 8 днів після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

45 У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат) і 1.193 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

У цьому дослідженні сполуки 1.101 і 1.221 виявляють гарну активність (придушення ≤ 50 %).

Приклад В-11: Лікувальна обробка від *Russcinea recondita* (бура іржа) на пшениці

50 Сегменти листя пшениці поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямкові) і інокують суспензією спор грибів. Через 1 день після інокуляції сегменти листів обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 8 днів після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат) і 1.193 виявляють дуже гарну активність (придушення ≤ 80 %).

55 Приклад В-12: Вплив на *Pyricularia oryzae* (пірикуляріоз рису) на рисі

Сегменти листя рису поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямкові) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 5 днів після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

60 У цьому дослідженні сполуки 1.166 (S)-енантіомер і 1.166 (рацемат) виявляють гарну

активність (придушення $\leq 50\%$).

Приклад В-13: Вплив на *Leptosphaeria nodorum* (*Septoria nodorum*; септориоз колоскової луски пшениці) на пшениці

Сегменти листя пшениці поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямкові) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 4 дні після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

У цьому дослідженні сполуки 1.098, 1.101, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193 і 1.221 виявляють гарну активність (придушення $\leq 50\%$).

Приклад В-14: Вплив на *Pyrenophora teres* (сітчаста плямистість) на ячмені

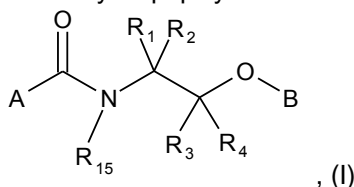
Сегменти листя ячменю поміщають на агар у багатолункові планшети (24-ямкові) і обприскують досліджуваними розчинами (0,02 % активного інгредієнта). Після сушіння кружечки листя інокують суспензією спор грибів. Після відповідної інкубації активність сполуки оцінюють через 4 дні після інокуляції, як попереджувальну фунгіцидну активність.

У цьому дослідженні сполуки 1.100, 1.101, 1.103, 1.166 (S)-енантіомер, 1.166 (рацемат), 1.193, 1.221 і 1.239 виявляють дуже гарну активність (придушення $\leq 80\%$).

У цьому дослідженні сполуки 1.099 і 1.102 виявляють гарну активність (придушення $\leq 50\%$).

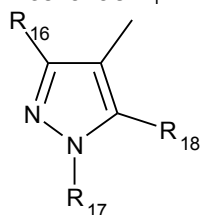
ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I



де

A означає A₁



R₁ означає C₁-C₆-алкіл;

R₂ означає водень;

R₃ та R₄ означають водень;

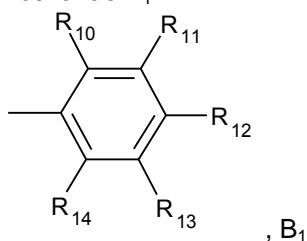
R₁₅ означає водень;

R₁₆ означає C₁-C₄-галогеналкіл;

R₁₇ означає C₁-C₄-алкіл;

R₁₈ означає водень;

B означає B₁



де

R₁₀ означає водень, C₁-C₆-алкіл або галоген;

R₁₁ означає водень, C₁-C₆-алкіл або галоген;

R₁₂ означає водень, галоген, C₁-C₆-алкілкарбоніл, -C(O)H, нітрогрупу або C₂-C₆-алкенілоксигрупу або означає C₂-C₆-алкенілоксигрупу, яка заміщена галогеном;

R₁₃ означає водень, C₁-C₆-алкіл або галоген; та

R₁₄ означає водень, C₁-C₆-алкіл або галоген, за умови, що принаймні один з R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ та R₁₄ не означає водень.

2. Сполука формули I за п. 1, в якій R_{16} означає CF_2H та R_{17} означає метил.
3. Композиція для боротьби і захисту від зараженням фітопатогенними мікроорганізмами, що містить сполуку формули I за п. 1 та інертний носій.

Комп'ютерна верстка Л. Ціхановська

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