



УКРАЇНА

(19) UA (11) 87480 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 471/20 (2006.01)

C07D 495/20 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01P 7/04

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

(54) ПОХІДНІ СПІРОПІПЕРИДИНУ, СПОСІБ БОРОТЬБИ З КОМАХАМИ ТА ПРОМІЖНА СПОЛУКА

1

(21) a200607584

(22) 09.12.2004

(24) 27.07.2009

(86) PCT/IB2004/004083, 09.12.2004

(31) 0328905.5

(32) 12.12.2003

(33) GB

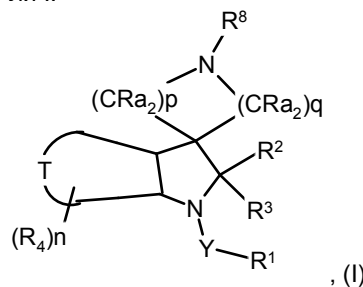
(46) 27.07.2009, Бюл.№ 14, 2009 р.

(72) МОЛЛЕЙРЕС ЛУІ-П'ЄР, СН, КАССЕР ЖЕ-
РОМ, FR/СН, СЕДЕРБАУМ ФРЕДРІК, SE/СН, МАІ-
ЕНФІШ ПЕТЕР, СН

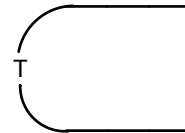
(73) СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, СН

(56) WO 0027845, A, 18.05.2000

WO 02094825, A, 28.11.2002

CIGANEK: "Tertiary Carbinamines by Addition of
Organocerium Reagents to Nitriles" J.ORG.CHEM.,
vol.57, 1992, pages 4521-4527(57) 1. Спосіб боротьби й контролювання комах,
який включає нанесення на комах, на вогнище
комах або на рослини, що піддані нашествю комах,
інсектицидно ефективною кількості сполуки форму-
ли I:у якій Y означає простий зв'язок, C=O, C=S або
S(O)_m, де m дорівнює 0, 1 або 2;R¹ означає водень, необов'язково заміщений ал-
кіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл,
необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокар-
боніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбо-
ніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбо-
ніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково
заміщений гетероарил, необов'язково заміщену
алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилокси-
групу, необов'язково заміщену гетероарилоксигру-
пу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу,

2

ціаногрупу, необов'язково заміщений алкеніл, не-
обов'язково заміщений алкініл, необов'язково за-
міщений циклоалкіл, необов'язково заміщений
циклоалкеніл, форміл, необов'язково заміщений
гетероцикліл, необов'язково заміщену алкілтіогру-
пу, NO або NR¹³R¹⁴, де R¹³ й R¹⁴ незалежно озна-
чають водень, COR¹⁵, необов'язково заміщений
алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язко-
во заміщений гетероарил, необов'язково заміще-
ний гетероцикліл або R¹³ й R¹⁴ разом з атомом N,
до якого вони приєднані, утворюють групу -
N=C(R¹⁶)-NR¹⁷R¹⁸, R¹⁵ означає H, необов'язково
заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкокси-
групу, необов'язково заміщений арил, необов'яз-
ково заміщену арилоксигрупу, необов'язково за-
міщений гетероарил, необов'язково заміщену
гетероарилоксигрупу або NR¹⁹R²⁰, R¹⁶, R¹⁷ й R¹⁸,
кожен, незалежно означають H або нижчий алкіл;
R¹⁹ й R²⁰ незалежно означають необов'язково за-
міщений алкіл, необов'язково заміщений арил або
необов'язково заміщений гетероарил;
R² й R³ незалежно означають водень, галоген,
ціаногрупу, необов'язково заміщений алкіл, необо-
в'язково заміщену алкоксигрупу або необов'язково
заміщений арил; кільцеозначає 5- або 6-членне гетероароматичне кільце;
кожен R⁴ незалежно означає галоген, нітрогрупу,
ціаногрупу, необов'язково заміщений C₁-C₈алкіл,
необов'язково заміщений C₂-C₆алкеніл, необов'яз-
ково заміщений C₂-C₆алкініл, необов'язково замі-
щений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений
алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламі-
нокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламі-
нокарбоніл, необов'язково заміщений C₃-
C₇циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, не-
обов'язково заміщений гетероарил, необов'язково
заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену
алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилокси-
групу, необов'язково заміщену гетероарилоксигру-

(13) C2

(11) 87480

(19) UA

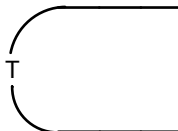
пу, неонов'язково заміщену алкілтіогрупу або $R^{21}R^{22}N$, де R^{21} й R^{22} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або R^{21} й R^{22} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибрані із групи, яка включає O, N й S, і яке неонов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може неонов'язково містити як замісники галоген; n дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен Ra незалежно означає водень, галоген, гідроксигрупу, ціаногрупу, неонов'язково заміщений C_1 - C_8 алкіл, неонов'язково заміщений C_2 - C_6 алкеніл, неонов'язково заміщений C_2 - C_6 алкініл, неонов'язково заміщений алкоксикарбоніл, неонов'язково заміщений алкілкарбоніл, неонов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, неонов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, неонов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкіл, неонов'язково заміщений арил, неонов'язково заміщений гетероарил, неонов'язково заміщений гетероцикліл, неонов'язково заміщену алкоксигрупу, неонов'язково заміщену арилоксигрупу, неонов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, неонов'язково заміщену алкілтіогрупу, неонов'язково заміщену арилтіогрупу або $R^{23}R^{24}N$, де R^{23} й R^{24} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або R^{23} й R^{24} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибрані із групи, яка включає N, O й S, і яке неонов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 групи Ra, приєднані до одного атома вуглецю, означають =O, або 2 групи Ra, приєднані до сусідніх атомів вуглецю, утворюють зв'язок, або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членне кільце, яке може бути насиченим або ненасиченим і яке може містити 1 або 2 гетероатоми, вибрані із групи, яка включає O, N й S, і яке неонов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами; або 2 групи Ra спільно утворюють групу $-CH_2-$, $-CH=CH-$ або $-CH_2CH_2-$;

p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6; q дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6, за умови, що $p+q$ дорівнює 1, 2, 3, 4, 5 або 6;

R^8 означає неонов'язково заміщений алкіл, неонов'язково заміщений алкеніл, неонов'язково заміщений алкініл, неонов'язково заміщений циклоалкіл, неонов'язково заміщений арил, неонов'язково заміщену алкоксигрупу, неонов'язково заміщену арилоксигрупу, неонов'язково заміщений алкоксикарбоніл, неонов'язково заміщений алкілкарбоніл або неонов'язково заміщений алкенілкарбоніл; або її солей або N-оксидів.

2. Спосіб за п. 1, у якому кільце



означає 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, у якому елементами кільця незалежно є CH, S, N, NR^4 , O або CR^4 , за умови, що принаймні один елемент кільця не являє собою CH або CR^4 і що в кільці міститься не більше одного атома O або S.

3. Спосіб за п. 1 або п. 2, у якому Y означає простий зв'язок або $C=O$.

4. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому R^2 й R^3 , кожен, незалежно означають водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу або ціаногрупу.

5. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому R^1 означає водень, C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_6 ціаноалкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де гетероарильна група може неонов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення гетероарильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, неонов'язково заміщеного галогеном), арил(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група може неонов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення арильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, неонов'язково заміщеного галогеном), гетероарил (який може неонов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення гетероарильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, неонов'язково заміщеного галогеном), C_1 - C_6 алкілкарбоніламіно(C_1 - C_6)алкіл, арил (який може неонов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галогеналкоксигрупу, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення арильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, неонов'язково заміщеного галогеном), C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галогеналкоксигрупу, феноксигрупу (де фенільна група неонов'язково містить

як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарилкоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), гетероциклілоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), ціаногрупу, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₅-C₇циклоалкеніл, гетероцикліл (який необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), C₁-C₆алкілтіогрупу, C₁-C₆галогеналкілтіогрупу або NR¹³R¹⁴, де R¹³ й R¹⁴ незалежно означають водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксі(C₁-C₆)алкіл, феніл (який може необов'язково містити як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу, діалкіламіногрупу або C₁-C₄алкоксикарбоніл), феніл(C₁-C₆)алкіл (де фенільна група може необов'язково містити як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу, діалкіламіногрупу, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆алкоксикарбоніл, або два сусідні положення фенільного кільця можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного галогеном), гетероарил(C₁-C₆)алкіл (де гетероарильна група може необов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галогеналкоксигрупу, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆алкілтіогрупу, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення гетероарильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного галогеном) або гетероарил (який може необов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу, C₁-C₄алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, фенілоксикарбоніламіногрупу (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу або феніламіногрупу (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу)).

6. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому кожен R⁴ незалежно означає галоген, ціаногрупу, C₁-C₈алкіл, C₁-C₈галогеналкіл, C₁-C₆ціаноалкіл, C₁-C₆алкоксі(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-

C₆)алкіл, C₅-C₆циклоалкеніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксі(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілоксі(C₁-C₆)алкіл, арилоксі(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆карбоксіалкіл, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкенілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкінілкарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкенілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₃-C₆алкінілоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, арилоксикарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілтіо(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфініл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆)алкіл, амінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, ді(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₁-C₆)алкіл, феніл(C₁-C₄)алкіл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C₁-C₄)алкіл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), гетероцикліл(C₁-C₄)алкіл (де гетероциклільна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), гетероцикліл(C₁-C₄)алкіл (де гетероциклільна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), C₂-C₆алкеніл, амінокарбоніл(C₂-C₆)алкеніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₂-C₆)алкеніл, ді(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₂-C₆)алкеніл, феніл(C₂-4)алкеніл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), C₂-C₆алкініл, триметилсиліл(C₂-C₆)алкініл, амінокарбоніл(C₂-C₆)алкініл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл(C₂-C₆)алкініл, ді(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл(C₂-C₆)алкініл, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₃-C₇циклоалкіл, C₃-C₇галогенциклоалкіл, C₃-C₇ціаноциклоалкіл, C₁-C₃алкіл(C₃-C₇)циклоалкіл, C₁-C₃алкіл(C₃-C₇)галогенциклоалкіл, феніл (який необов'язково містить як замісники галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксигрупу, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄галогеналкоксигрупу, CN, NO₂, арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил (який необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), або 2 сусідні групи R⁴ разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген, C₁-C₈алкоксигрупу, C₁-C₆галогеналкоксигрупу, феноксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), гетероарилкоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксигрупу або C₁-C₆галогеналкоксигрупу), C₁-C₈алкілтіогрупу або

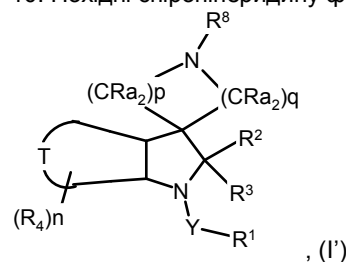
$R^{19}R^{20}N$, де R^{19} й R^{20} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або R^{19} й R^{20} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибрані з O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами; і n дорівнює 0, 1, 2 або 3.

7. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому R^3 означає C_1 - C_{10} алкіл, C_1 - C_{10} галогеналкіл, арил(C_1 - C_6)алкіл (де арильна тупа, необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), арилкарбоніл(C_1 - C_6)алкіл (де арильна група може необов'язково містити як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу й алкільна група може необов'язково бути заміщена арилом), C_2 - C_8 алкеніл, C_2 - C_8 галогеналкеніл, арил(C_2 - C_6)алкеніл (де арильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або два сусідні замісники можуть циклізуватися з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця), гетероарил(C_2 - C_6)алкеніл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), C_3 - C_7 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл або арил(C_2 - C_6)алкенілкарбоніл (де арильна група може необов'язково містити як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), або $-C(R^{51})(R^{52})-[C(R^{53})=C(R^{54})=]z-R^{55}$, де z дорівнює 1 або 2, R^{53} й R^{54} , кожен, незалежно означають H, галоген або C_1 - C_2 алкіл, R^{51} й R^{52} , кожен, незалежно означають H, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл й R^{55} означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

8. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому всі Ra означають водень.

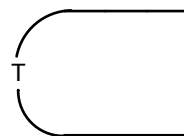
9. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, у якому p дорівнює 1 або 2 й q дорівнює 2 або 3.

10. Похідні спіропиперидину формули I'



у якій Y означає C=O, C=S;

R^1 означає водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений циклоалкеніл, форміл, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкілтіогрупу, NO або $NR^{13}R^{14}$, де R^{13} й R^{14} незалежно означають водень, COR^{15} , необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл, або R^{13} й R^{14} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють групу $-N=C(R^{16})-NR^{17}R^{18}$, R^{15} означає H, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу або $NR^{19}R^{20}$, R^{16} , R^{17} й R^{18} , кожен, незалежно означають H або нижчий алкіл; R^{19} й R^{20} незалежно означають необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил; R^2 й R^3 незалежно означають водень, галоген, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу або необов'язково заміщений арил; кільце



означає 5- або 6-членне гетероароматичне кільце; кожен R^4 незалежно означає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкіл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкеніл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково

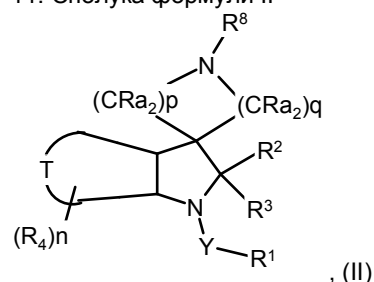
заміщений гетероциклі, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкілтіогрупу або $R^{21}R^{22}N$, де R^{21} й R^{22} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або R^{21} й R^{22} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибрані із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген; n дорівнює 0, 1, 2 або 3; кожен Ra незалежно означає водень, галоген, гідроксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1 - C_8 алкіл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкеніл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероциклі, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкілтіогрупу або $R^{23}R^{24}N$, де R^{23} й R^{24} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкіл, C_3 - C_7 циклоалкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, C_3 - C_7 циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, C_2 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або R^{23} й R^{24} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибрані із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або

двома C_1 - C_6 алкільними групами, або 2 групи Ra, приєднані до одного атома вуглецю, означають $=O$, або 2 групи Ra, приєднані до сусідніх атомів вуглецю, утворюють зв'язок, або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членне кільце, яке може бути насиченим або ненасиченим й яке може містити 1 або 2 гетероатоми, вибрані із групи, яка включає N, O й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкільними групами; або 2 групи Ra спільно утворюють групу $-CH_2-$, $-CH=CH-$ або $-CH_2CH_2-$;

p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6; q дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6, за умови, що p+q дорівнює 1, 2, 3, 4, 5 або 6;

R^8 означає необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл або необов'язково заміщений алкенілкарбоніл; або їх солі або N-оксиди.

11. Сполука формули II



у якій R^8 означає H або трет-бутоксикарбоніл й n, p, q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 й Ra є такими, як визначено в п. 10.

12. Інсектицидна композиція, яка включає інсектицидно ефективну кількість сполуки формули I за п. 1.

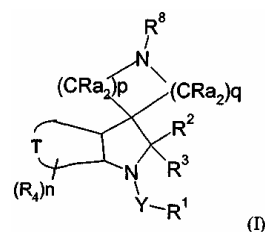
Даний винахід стосується гетероспіроіндолінових похідних, способів їх одержання, інсектицидних, акарицидних, молюскоцидних і нематоцидних композицій, які їх містять, і способів їх застосування для боротьби й контролю шкідників - комах, кліщів, молюсків і нематод.

Азаспіроіндоліни, які мають фармацевтичні характеристики, розкриті, наприклад, в WO02/94825 й WO00/27845. Шляхи синтезу деяких сполук описані, наприклад, у публікаціях [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (1995), 5, 1875 й Tetrahedron Letters (2001) 42, 999].

Відповідно до винаходу несподівано виявлено, що деякі гетероспіроіндоліни мають інсектицидні властивості.

Тому даний винахід стосується способу боротьби й контролювання комах, кліщів, нематод і молюсків, який включає нанесення на шкідників, на вогнище шкідників або на рослини, підданих навалі шкідників, інсектицидно, акарицидно, нема-

тоцидно або молюскоцидно ефективної кількості сполуки формули (I):



у якій Y означає простий зв'язок, $C \equiv O$, $C=S$ або $S(O)_m$, де m дорівнює 0, 1 або 2; R^1 означає водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетеро-

арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкїніл, необов'язково заміщений циклоалкїл, необов'язково заміщений циклоалкенїл, формїл, необов'язково заміщений гетероциклїл, необов'язково заміщену алкїлтіогрупу, NO або $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$, де R^{13} й R^{14} незалежно означають водень, COR¹⁵, необов'язково заміщений алкїл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероциклїл або R^{13} й R^{14} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють групу $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^{16})-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$, R^{15} означає H, необов'язково заміщений алкїл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу або $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$, R^{16} , R^{17} й R^{18} кожен незалежно означають H або нижчий алкїл; R^{19} й R^{20} незалежно означають необов'язково заміщений алкїл, необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил; R^2 й R^3 незалежно означають водень, галоген, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкїл, необов'язково заміщену алкоксигрупу або необов'язково заміщений арил; кільце



означає 5-або 6-членне гетероароматичне кільце; кожен R незалежно означає галоген, нїтрогрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1 - C_8 алкїл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкенїл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкїніл, необов'язково заміщений алкоксикарбонїл, необов'язково заміщений алкїлкарбонїл, необов'язково заміщений алкїламінокарбонїл, необов'язково заміщений діалкїламінокарбонїл, необов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкїл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероциклїл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкїлтіогрупу або $\text{R}^{21}\text{R}^{22}\text{N}$, де R^{21} й R^{22} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкїл, C_3 - C_7 циклоалкїл, C_3 - C_6 алкенїл, C_3 - C_6 алкїніл, C_3 - C_7 циклоалкїл(C_1 - C_4)алкїл, C_2 - C_6 галогеналкїл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкїл, C_1 - C_6 алкоксикарбонїл або R^{21} й R^{22} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклїчне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкїльними групами, або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклїчне або гетероциклїчне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген; n дорівнює 0, 1, 2 або 3; кожен Ra незалежно означають водень, галоген, гідроксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C_1 - C_8 алкїл,

необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкенїл, необов'язково заміщений C_2 - C_6 алкїніл, необов'язково заміщений алкоксикарбонїл, необов'язково заміщений алкїлкарбонїл, необов'язково заміщений алкїламінокарбонїл, необов'язково заміщений діалкїламінокарбонїл, необов'язково заміщений C_3 - C_7 циклоалкїл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероциклїл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкїлтіогрупу, необов'язково заміщену арилтіогрупу або $\text{R}^{23}\text{R}^{24}\text{N}$, де R^{23} й R^{24} незалежно означають водень, C_1 - C_8 алкїл, C_3 - C_7 циклоалкїл, C_3 - C_6 алкенїл, C_3 - C_6 алкїніл, C_3 - C_7 циклоалкїл(C_1 - C_4)алкїл, C_2 - C_6 галогеналкїл, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкїл, C_1 - C_6 алкоксикарбонїл або R^{23} й R^{24} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклїчне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає N, O й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкїльними групами, або 2 групи Ra, приєднані до одного атома вуглецю, означають $=\text{O}$, або 2 групи Ra, приєднані до сусідніх атомів вуглецю, утворюють зв'язок, або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3- - 7-членне кільце, яке може бути насиченим або ненасиченим й яке може містити 1 або 2 гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1 - C_6 алкїльними групами; або 2 групи Ra спільно утворюють групу $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$ або $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$; p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6; q дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6 за умови, що $p+q$ дорівнює 1, 2, 3, 4, 5 або 6; R^8 означає необов'язково заміщений алкїл, необов'язково заміщений алкенїл, необов'язково заміщений алкїніл, необов'язково заміщений циклоалкїл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений алкоксикарбонїл, необов'язково заміщений алкїлкарбонїл або необов'язково заміщений алкенїлкарбонїл; або її солей або N-оксидів.

Сполуки формули (I) можуть існувати у вигляді різних геометричних або оптичних ізомерів або в різних таутомерних формах. До обсягу даного винаходу входять всі такі ізомери й таутомери і їх суміші у всіх співвідношеннях, а також ізотопозаміщені форми, такі як дейтеровані сполуки.

Сполуки, наведені нижче в таблицях від 1 до 13, ілюструють сполуки, запропоновані в даному винаході.

Кожен алкїльний фрагмент, окремо або у вигляді частини більшої групи (такої як алкоксигрупа, алкоксикарбонїл, алкїлкарбонїл, алкїламінокарбонїл, діалкїламінокарбонїл), має лінійний або розгалужений ланцюг й означає, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, н-гексил, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, ізобутил, трет-бутил або неопентил. Алкїльні групи переважно являють собою C_1 - C_{12} алкїльні групи, але переважно $-\text{C}_1$ - $\text{C}_{10}-$, більш переважно $-\text{C}_1$ - C_8- , ще більш переважно $-\text{C}_1$ - C_6- і найбільш переважно $-\text{C}_1$ - C_4 алкїльні групи.

Необов'язкові замісники алкільного фрагмента, якщо вони містяться (окремо або у вигляді частини більшої групи, такої як алкоксигрупа, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл), включають один або більшу кількість галогенів, нітрогрупу, ціаногрупу, NCS-, C₃-C₇циклоалкіл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), C₅-C₇циклоалкеніл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), гідроксигрупу, C₁-C₁₀алкоксигрупу, C₁-C₁₀алкокси(C₁-C₁₀)алкоксигрупу, три(C₁-C₄)алкілсиліл(C₁-C₆)алкоксигрупу, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₁₀)алкоксигрупу, C₁-C₁₀галогеналкоксигрупу, арил(C₁-C₄)-алкоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена), C₃-C₇циклоалкоксигрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), C₂-C₁₀алкенілоксигрупу, C₂-C₁₀алкінілоксигрупу, SH, C₁-C₁₀алкілтіогрупу, C₁-C₁₀галогеналкілтіогрупу, арил(C₁-C₄)алкілтіогрупу (де арильна група необов'язково заміщена), C₃-C₇циклоалкілтіогрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), три(C₁-C₄)алкілсиліл(C₁-C₆)алкілтіогрупу, арилтіогрупу (де арильна група необов'язково заміщена), C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галогеналкілсульфініл, арилсульфоніл (де арильна група може бути необов'язково заміщена), три(C₁-C₄)алкілсиліл, арилди(C₁-C₄)алкілсиліл, (C₁-C₄)алкілдіарилсиліл, триарилсиліл, C₁-C₁₀алкілкарбоніл, NO₂C, C₁-C₁₀алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл, N-(C₁-C₃алкіл)-N-(C₁-C₃алкокси)амінокарбоніл, C₁-C₆алкілкарбонілоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена), ди(C₁-C₆)алкіламінокарбонілоксигрупу, оксими, такі як =NOалкіл, =NOгалогеналкіл й =NOарил (сам необов'язково заміщений), арил (сам необов'язково заміщений), гетероарил (сам необов'язково заміщений), гетероцикліл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена), гетероциклілоксигрупу (де гетероциклільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу, ди(C₁-C₆)алкіламіногрупу, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, N-(C₁-C₆)алкілкарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, C₂-C₆алкенілкарбоніл, C₂-C₆алкінілкарбоніл, C₃-C₆алкенілоксикарбоніл, C₃-C₆алкінілоксикарбоніл, арилоксикарбоніл (де арильна група необов'язково заміщена) і арилкарбоніл (де арильна група необов'язково заміщена).

Алкенільні й алкінільні фрагменти можуть знаходитися у вигляді лінійних або розгалужених ланцюгів й алкенільні фрагменти, якщо це є підходящим, можуть знаходитися в (E)- або (Z)-конфігурації. Прикладами є вініл, аліл і пропаргіл.

Необов'язкові замісники алкенілу або алкінілу, якщо вони містяться, включають необов'язкові замісники, вказані вище для алкільного фрагмента.

У контексті даного опису ацил означає необов'язково заміщений C₁-C₆алкілкарбоніл (напри-

клад, ацетил), необов'язково заміщений C₂-C₆алкенілкарбоніл, необов'язково заміщений C₂-C₆алкінілкарбоніл, необов'язково заміщений арилкарбоніл (наприклад, бензоїл) або необов'язково заміщений гетероарилкарбоніл.

Галоген означає фтор, хлор, бром або йод.

Галогеналкільні групи являють собою алкільні групи, які заміщені одним або більшою кількістю однакових або різних атомів галогенів й являють собою, наприклад, CF₃, CF₂Cl, CF₃CH₂ або CHF₂CH₂.

У контексті даного опису терміни "арил" й "ароматична кільцева система" стосуються кільцевих систем, які можуть бути моно-, бі- або трициклічними. Приклади таких кілець включають феніл, нафталініл, антраценіл, іденіл і фенантренил. Переважною арильною групою є феніл. Крім того, терміни "гетероарил", "гетероароматичне кільце" й "гетероароматична кільцева система" стосуються ароматичних кільцевих систем, які містять принаймні один гетероатом і включають одне кільце або два або більшу кількість конденсованих кілець. Переважно, якщо моноциклічні системи містять до 3, а біциклічні системи - до 4 гетероатомів, які переважно вибирати із групи, яка включає азот, кисень і сірку. Приклади таких груп включають фурил, тієніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, ізотiazоліл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,2,3-тіадіазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,2,5-тіадіазоліл, піридил, піримідиніл, піридазиніл, піразиніл, 1,2,3-триазиніл, 1,2,4-триазиніл, 1,3,5-триазиніл, бензофурил, бензізофурил, бензотієніл, бензізотієніл, індоліл, ізоіндоліл, індазоліл, бензотіазоліл, бензізотіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензімідазоліл, 2,1,3-бензоксадіазол, хінолініл, ізохінолініл, цинолініл, фталазиніл, хіназолініл, хіноксалініл, нафтиридиніл, бензотриазиніл, пуриніл, птеридиніл й індолізиніл. Переважні приклади гетероароматичних радикалів включають піридил, піримідил, триазиніл, тієніл, фурил, оксазоліл, ізоксазоліл, 2,1,3-бензоксадіазол і тiazоліл.

Терміни гетероцикл і гетероцикліл означають неароматичне кільце, яке містить до 10 атомів, які включають один або більшу кількість (переважно - 1 або 2) гетероатомів, вибраних із групи, яка включає O, S й N. Приклади таких кілець включають 1,3-діоксолан, тетрагідрофуран і морфолін.

Необов'язкові замісники гетероциклілу, якщо вони містяться, включають C₁-C₆алкіл й C₁-C₆галогеналкіл, а також необов'язкові замісники, вказані вище для алкільного фрагмента.

Циклоалкіл включає циклопропіл, циклопентил і циклогексил.

Циклоалкеніл включає циклопентеніл і циклогексеніл.

Необов'язкові замісники циклоалкілу й циклоалкенілу, якщо вони містяться, включають C₁-C₃алкіл, а також необов'язкові замісники, вказані вище для алкільного фрагмента.

Карбоциклічні кільця включають арильні, циклоалкільні й циклоалкенільні групи.

Необов'язкові замісники арилу й гетероарилу, якщо вони містяться, незалежно вибираються із

групи, яка включає галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, NCS-, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси- (C₁-C₆)алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), C₅-C₇циклоалкеніл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), гідроксигрупу, C₁-C₁₀алкоксигрупу, C₁-C₁₀алкокси(C₁-C₁₀)алкоксигрупу, три(C₁-C₄)алкілсиліл(C₁-C₆)алкоксигрупу, C₁-C₆алкоксикарбоніл(C₁-C₁₀)алкоксигрупу, C₁-C₁₀галогеналкоксигрупу, арил(C₁-C₄)алкоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена галогеном або C₁-C₆алкіл), C₃-C₇циклоалкоксигрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), C₂-C₁₀алкенілоксигрупу, C₂-C₁₀алкінілоксигрупу, SH, C₁-C₁₀алкілтіогрупу, C₁-C₁₀галогеналкілтіогрупу, арил(C₁-C₄)алкілтіогрупу, C₃-C₇циклоалкілтіогрупу (де циклоалкільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), три(C₁-C₄)-алкілсиліл(C₁-C₆)алкілтіогрупу, арилтіогрупу, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галогеналкілсульфініл, арилсульфоніл, три(C₁-C₄)алкілсиліл, арилди(C₁-C₄)-алкілсиліл, (C₁-C₄)алкілдіарилсиліл, триарилсиліл, C₁-C₁₀алкілкарбоніл, HO₂C, C₁-C₁₀алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-C₆алкіл)-амінокарбоніл, N-(C₁-C₃алкіл)-N-(C₁-C₃алкокси)амінокарбоніл, C₁-C₆алкілкарбонілоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбонілоксигрупу, арил (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероарил (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероцикліл (сам необов'язково заміщений C₁-C₆алкілом або галогеном), арилоксигрупу (де арильна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероарилоксигрупу (де гетероарильна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероциклілоксигрупу (де гетероциклільна група необов'язково заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу, ди(C₁-C₆)алкіламіногрупу, C₁-C₆алкілкарбоніламіногрупу, N-(C₁-C₆)алкілкарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, арилкарбоніл (де арильна група сама необов'язково заміщена галогеном або C₁-C₆алкілом) або два сусідні положення арильної або гетероарильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного галогеном або C₁-C₆алкілом. Інші замісники арилу й гетероарилу включають арилкарбоніламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), (C₁-C₆)алкілоксикарбоніламіногрупу (C₁-C₆)алкілоксикарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арилоксикарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арилсульфоніламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арилсульфоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арил-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу (де арильна група заміщена

C₁-C₆алкілом або галогеном), ариламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероариламіногрупу (де гетероарильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), гетероцикліламіногрупу (де гетероциклічна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), амінокарбоніламіногрупу, C₁-C₆алкіламінокарбоніламіногрупу, ди(C₁-C₆)алктамінокарбоніламіногрупу, ариламінокарбоніламіногрупу де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), арил-N-(C₁-C₆)алкіламінокарбоніламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном), C₁-C₆алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, ди(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу, ариламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном) і арил-N-(C₁-C₆)алкіламінокарбоніл-N-(C₁-C₆)алкіламіногрупу (де арильна група заміщена C₁-C₆алкілом або галогеном).

Для заміщених фенільних фрагментів, гетероциклічних і гетероарильних груп переважно, щоб один або більша кількість замісників були незалежно вибрані із групи, яка включає галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксигрупу, C₁-C₆галогеналкоксигрупу, C₁-C₆алкілтіогрупу, C₁-C₆галогеналкілтіогрупу, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галогеналкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆галогеналкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл, нітрогрупу, ціаногрупу, CO₂H, C₁-C₆алкілкарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбоніл, R²⁵R²⁶N або R²⁷R²⁸NC(O); де R²⁵, R²⁶, R²⁷ й R²⁸ незалежно означають водень або C₁-C₆алкіл. Іншими переважними замісниками є арильні й гетероарильні групи.

Галогеналкенільні групи являють собою алкенільні групи, які заміщені одним або більшою кількістю однакових або різних атомів галогенів.

Слід розуміти, що діалкіламінові замісники включають такі, у яких діалкільні групи разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає N, O й S, і яке необов'язково заміщене однією або двома незалежно обраними (C₁-C₆)алкільними групами. Якщо гетероциклічні кільця утворюються шляхом сполуки двох груп, приєднаних до атома N, то переважно, якщо отримані кільця являють собою піролідін, піперидин, тіоморфолін і морфолін, кожний з яких може бути заміщений однією або двома незалежно обраними (C₁-C₆)алкільними групами.

Переважно, якщо необов'язкові замісники алкільного фрагмента включають один або більшу кількість замісників, які представляють собою галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, HO₂C, C₁-C₁₀алкоксигрупу (саму необов'язково заміщену C₁-C₁₀алкоксигрупою), арил(C₁-C₄)алкоксигрупу, C₁-C₁₀алкілтіогрупу, C₁-C₁₀алкілкарбоніл, C₁-C₁₀алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкіламінокарбоніл, ди(C₁-C₆алкіл)амінокарбоніл, (C₁-C₆) алкілкарбонілоксигрупу, необов'язково заміщений феніл, гетероарил, арилоксигрупу, арилкарбонілоксигрупу, гетероарилоксигрупу, гетероцикліл, гетероцикліло-

кільця, необов'язково заміщеного галогеном) або гетероарил(C_1-C_3)алкіл (де гетероарильна група може необов'язково містити як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу, C_1-C_6 галогеналкоксигрупу, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілтіогрупу, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_1-C_6 алкілкарбоніламіногрупу, арилкарбоніл, або два сусідні положення арильної або гетероарильної системи можуть бути включені в цикл із утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного галогеном).

Ще більш переважно, якщо R^1 означає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, гетероарил(C_1 - C_3)алкіл (де гетероарильна група може необов'язково містити як замісники галоген, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл і де гетероарильна група означає тiazольное, піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце), гетероарил (який необов'язково містить як замісники галоген, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл і де гетероарильна група означає піридинове, піримідинове, 2,1,3-бензоксадіазольное, піразинове або піридазинове кільце), C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіл, C_1 - C_6 алкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6)алкіламіногрупу або гетероарил(C_1 - C_3)алкіламіногрупу (де гетероарильна група може необов'язково містити як замісники галоген, ціаногрупу, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл і де гетероарильна група означає тiazольное, піридинове, піримідинове, піразинове або піридазинове кільце).

Найбільш переважно, якщо R^1 означає піридил (який необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_3 алкіл або C_1 - C_3 галогеналкіл), переважно - галогензаміщений піридил.

Переважно, якщо R^2 й R^3 незалежно означають водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкоксигрупу або ціаногрупу.

Більш переважно, якщо R^2 й R^3 незалежно означають водень, галоген, C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_2 галогеналкіл, C_1 - C_2 алкоксигрупу, ціаногрупу.

Ще більш переважно, якщо R^2 і R^3 незалежно означають водень або C_1 - C_4 алкіл.

Ще більш переважно, якщо R^2 й R^3 незалежно означають водень або метил.

Найбільш переважно, якщо R^2 й R^3 обидва означають водень.

Переважно, якщо кожен R^4 незалежно означають галоген, ціаногрупу, C_1-C_8 алкіл, C_1-C_8 галогеналкіл, C_1-C_6 ціаноалкіл, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_7 циклоалкіл(C_1-C_6)алкіл, C_5-C_6 циклоалкеніл(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкенілокси(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкінілокси(C_1-C_6)алкіл, арилокси(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 карбоксіалкіл, C_1-C_6 алкілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_2-C_6 алкенілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_2-C_6 алкінілкарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкенілоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_3-C_6 алкінілоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, арилоксикарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілтіо(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілсульфініл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкілсульфоніл(C_1-C_6)алкіл, амінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл,

ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_1-C_6)алкіл, феніл(C_1-C_4)алкіл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C_1-C_4)алкіл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), гетероцикліл(C_1-C_4)алкіл (де гетероциклільна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), C_2-C_6 алкеніл, амінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкеніл, феніл(C_{2-4})-алкеніл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), C_2-C_6 алкініл, триметилсиліл(C_2-C_6)алкініл, амінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, C_1-C_6 алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, ди(C_1-C_6)алкіламінокарбоніл(C_2-C_6)алкініл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_3-C_7 циклоалкіл, C_3-C_7 галогенциклоалкіл, C_3-C_7 ціаноциклоалкіл, C_1-C_3 алкіл(C_3-C_7)-циклоалкіл, C_1-C_3 алкіл(C_3-C_7)галогенциклоалкіл, феніл (який необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил (який необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), гетероцикліл (де гетероциклільна група необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може містити як замісники галоген, C_1-C_8 алкоксигрупу, C_1-C_8 галогеналкоксигрупу, феноксигрупу (необов'язково утримуючу як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 галогеналкоксигрупу, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), гетероарилоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), C_1-C_8 алкілтіогрупу або $R^{19}R^{20}N$, де R^{19} й R^{20} незалежно означають водень, C_1-C_8 алкіл, C_3-C_7 циклоалкіл, C_3-C_6 алкеніл, C_3-C_6 алкініл, C_2-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл або R^{19} й R^{20} разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C_1-C_6 алкільними групами; n дорівнює 0, 1, 2 або 3.

Більш переважно, якщо кожен R^4 незалежно означають галоген, ціаногрупу, C_1-C_8 алкіл, C_1-C_8 галогеналкіл, C_1-C_8 ціаноалкіл, C_1-C_6 алкокси(C_1-

C_6)алкіл, C_2-C_6 алкініл, триметилсиліл(C_2-C_6)алкініл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_3-C_7 циклоалкіл, C_1-C_3 алкіл(C_3-C_7)циклоалкіл, феніл (який необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероцикліл (який необов'язково містить як замісники галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 алкоксигрупу або C_1-C_6 галогеналкоксигрупу), C_1-C_8 алкоксигрупу, C_1-C_8 галогеналкоксигрупу, феноксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарилоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, C_1-C_3 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл, C_1-C_3 алкоксигрупу або C_1-C_3 галогеналкоксигрупу), ди(C_1-C_8) алкіламіногрупу, або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген; n дорівнює 0, 1, 2 або 3.

Ще більш переважно, якщо кожен R^4 незалежно означають галоген, ціаногрупу, C_1-C_8 алкіл, C_1-C_8 галогеналкіл, C_1-C_8 ціаноалкіл, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6)алкіл, C_2-C_6 алкініл, гетероцикліл (необов'язково заміщений C_1-C_6 алкілом), C_1-C_8 алкоксигрупу, C_1-C_6 галогеналкоксигрупу, феноксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, ціаногрупу, C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл), гетероарилоксигрупу (яка необов'язково як замісники містить галоген, ціаногрупу, C_1-C_3 алкіл або C_1-C_3 галогеналкіл), ди(C_1-C_8)алкіламіногрупу або 2 сусідні групи R^4 разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген; n дорівнює 0, 1, 2 або 3.

Ще більш переважно, якщо кожен R^4 незалежно означають фтор, хлор, бром, ціаногрупу, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 ціаноалкіл або C_1-C_3 алкокси(C_1-C_3)алкіл; n дорівнює 0, 1 або 2.

Найбільш переважно, якщо кожен R^4 незалежно означають фтор, хлор, бром, C_1-C_4 алкіл або C_1-C_4 галогеналкіл; n дорівнює 1 або 2.

Переважно, якщо R^8 означає C_1-C_{10} алкіл, C_1-C_{10} галогеналкіл, арил(C_1-C_6)алкіл (де арильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C_1-C_6)алкіл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), арилкарбоніл-(C_1-C_6)алкіл (де арильна група може необов'язково містити як замісники галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галогеналкіл, C_1-C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу й алкільна група може необов'язково бути заміщена арилом), C_2-C_8 алкеніл, C_2-C_8 галогеналкеніл, арил(C_2-C_6)-

алкеніл (де арильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або два сусідні замісники можуть циклізуватися з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця), гетероарил(C_2 - C_6)-алкеніл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, або два сусідні замісники можуть циклізуватися з утворенням 5-, 6- або 7-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільця), C_2 - C_6 алкініл, феніл(C_2 - C_6)алкініл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), C_3 - C_7 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкілкарбоніл, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл або арил(C_2 - C_6)алкенілкарбоніл (де арильна група може необов'язково містити як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), або - $C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z дорівнює 1 або 2, R^{51} і R^{52} кожен незалежно означають H, галоген або C_1 - C_2 алкіл, R^{53} і R^{54} кожен незалежно означають H, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл і R^{55} означає необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

Більш переважно, якщо R^8 означає феніл(C_1 - C_4)алкіл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C_1 - C_6)алкіл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), феніл(C_2 - C_6)алкеніл (де фенільна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), гетероарил(C_2 - C_6)алкеніл (де гетероарильна група необов'язково містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу), або - $C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z дорівнює 1 або 2, R^{51} і R^{52} кожен незалежно означають H, галоген або C_1 - C_2 алкіл, R^{53} і R^{54} кожен незалежно означають H, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл і R^{55} означає необов'язково замі-

щений арил або необов'язково заміщений гетероарил.

Найбільш переважно, якщо R^8 означає - $C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, де z дорівнює 1 або 2, переважно - 1, R^{51} і R^{52} кожен незалежно означають H, галоген або C_1 - C_2 алкіл, R^{53} і R^{54} кожен незалежно означають H, галоген, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл і R^{55} означає феніл, який містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу або гетероарил, який містить як замісники галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу.

R^{51} і R^{52} переважно означають водень.

R^{53} і R^{54} переважно означають водень або галоген, особливо переважно - водень.

R^{55} переважно означає феніл, який містить від 1 до 3 замісників, вибраних із групи, яка включає галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 галогеналкоксигрупу, CN, NO_2 , арил, гетероарил, аміногрупу або діалкіламіногрупу.

Переважно, якщо кільце



представляє собою 5- або 6-членне гетероароматичне кільце, у якому елементами кільця незалежно є CH, S, N, NR^4 , O або CR^4 за умови, що принаймні один елемент кільця не представляє собою CH або CR^4 і що в кільці міститься не більше одного атома O або S.

Більш переважно, якщо кільце



представляє собою піридин, піримідин, піразин, піридазин, триазин, фуран, тіофен, пірол, імідазол, піразол, оксазол, тіазол, ізооксазол, ізотіазол, [1,2,3]триазол, [1,2,3]оксадіазол або [1,2,3]тіадіазол.

Переважно, якщо кожен Ra незалежно означають водень, галоген, ціаногрупу, C_1 - C_3 алкіл, гідроксигрупу або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють карбонільну групу.

Більш переважно, якщо кожен Ra незалежно означають водень, фтор, метил, гідроксигрупу або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють карбонільну групу.

Найбільш переважно, якщо всі Ra означають водень.

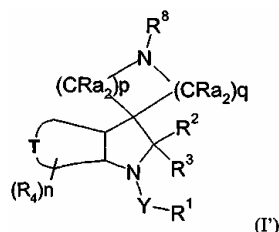
Переважно, якщо p дорівнює 1, 2 або 3 і q дорівнює 1, 2 або 3 і $p+q$ дорівнює 3, 4 або 5.

Більш переважно, якщо p дорівнює 1 або 2 і q дорівнює 2.

Найбільш переважно, якщо p і q обидва рівні 2.

Однією групою переважних сполук формули (I) є такі, у яких Y означає C(O) і R¹ означає NR¹³R¹⁴, де R¹³ й R¹⁴ є такими, як визначено вище.

Деякі сполуки формули I є новими. Однією групою нові сполуки є сполуки формули I'



у якій Y означає C=O, C=S; R¹ означає водень, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, амінокарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероциклілоксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений циклоалкеніл, форміл, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкілтіогрупу, NO або NR¹³R¹⁴, де R¹³ й R¹⁴ незалежно означають водень, COR¹⁵, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл або R¹³ й R¹⁴ разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють групу -N=C(R¹⁶)-NR¹⁷R¹⁸; R¹⁵ означає H, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу або NR¹⁹R²⁰; R¹⁶, R¹⁷ й R¹⁸ кожен незалежно означають H або нижчий алкіл; R¹⁹ й R²⁰ незалежно означають необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений арил або необов'язково заміщений гетероарил; R² й R³ незалежно означають водень, галоген, ціаногрупу, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщену алкоксигрупу або необов'язково заміщений арил; кільце



означає 5-або 6-членне гетероароматичне кільце;

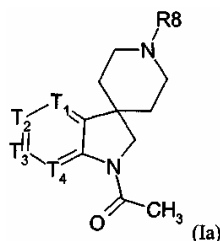
кожен R⁴ незалежно означають галоген, нітрогрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C₃-

C₇циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкілтіогрупу або R²¹R²²N, де R²¹ й R²² незалежно означають водень, C₁-C₈алкіл, C₃-C₇циклоалкіл, C₃-C₆алкеніл, C₃-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл, C₂-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл або R²¹ й R²² разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C₁-C₆алкільними групами, або 2 сусідні групи R⁴ разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке може необов'язково містити як замісники галоген; p дорівнює 0, 1, 2 або 3; кожен Ra незалежно означають водень, галоген, гідроксигрупу, ціаногрупу, необов'язково заміщений C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений C₂-C₆алкеніл, необов'язково заміщений C₂-C₆алкініл, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл, необов'язково заміщений алкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений діалкіламінокарбоніл, необов'язково заміщений C₃-C₇циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикліл, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщену гетероарилоксигрупу, необов'язково заміщену алкілтіогрупу, необов'язково заміщену арилтіогрупу або R²³R²⁴N, де R²³ й R²⁴ незалежно означають водень, C₁-C₆алкіл, C₃-C₇циклоалкіл, C₃-C₆алкеніл, C₃-C₆алкініл, C₃-C₇циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл, C₂-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆)алкіл, C₁-C₆алкоксикарбоніл або R²³ й R²⁴ разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне гетероциклічне кільце, яке може містити 1 або 2 додаткові гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C₁-C₆алкільними групами, або 2 групи Ra, приєднані до одного атома вуглецю, означають =O, або 2 групи Ra, приєднані до сусідніх атомів вуглецю, утворюють зв'язок, або 2 групи Ra разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3- - 7-членне кільце, яке може бути насиченим або ненасиченим й яке може містити 1 або 2 гетероатоми, вибраних із групи, яка включає O, N й S, і яке необов'язково може бути заміщене однією або двома C₁-C₆алкільними групами; або 2 групи Ra спільно утворюють групу -CH₂-, -CH=CH- або -CH₂CH₂; p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6; q дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5 або 6 за умови, що p+q дорівнює 1, 2, 3, 4, 5 або 6; R⁸ означає необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщену алкоксигрупу, необов'язково заміщену арилоксигрупу, необов'язково заміщений алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений алкілкарбоніл або необов'язково

заміщений алкенілкарбоніл; або їх солі або N-оксиди.

Сполуки, наведені нижче в таблицях I-DCCLXVII, ілюструють сполуки, запропоновані в даному винаході.

У таблиці I наведено 575 сполук формули Ia



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

Таблиця 1

Сполука №	R ⁸	C-R ^{4a}	C-R ^{4b}	C-R ^{4c}
I-1	4-хлорбензил	CH	CH	CH
I-2	цинаміл	CH	CH	CH
I-3	4-хлорцинаміл	CH	CH	CH
I-4	4-фторцинаміл	CH	CH	CH
I-5	4-бромцинаміл	CH	CH	CH
I-6	4-трифторметилцинаміл	CH	CH	CH
I-7	4-трифторметоксицинаміл	CH	CH	CH
I-8	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CH	CH
I-9	4-метоксицинаміл	CH	CH	CH
I-10	4-етоксицинаміл	CH	CH	CH
I-11	4-ціаноцинаміл	CH	CH	CH
I-12	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CH	CH
I-13	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CH	CH
I-14	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CH	CH
I-15	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CH	CH
I-16	3,5-дихлорцинаміл	CH	CH	CH
I-17	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CH	CH
I-18	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CH	CH
I-19	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CH	CH
I-20	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CH
I-21	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CH
I-22	3-піридин-4-ілаліл	CH	CH	CH
I-23	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CH	CH
I-24	4-хлорбензил	CF	CH	CH
I-25	цинаміл	CF	CH	CH
I-26	4-хлорцинаміл	CF	CH	CH
I-27	4-фторцинаміл	CF	CH	CH
I-28	4-бромцинаміл	CF	CH	CH
I-29	4-трифторметилцинаміл	CF	CH	CH
I-30	4-трифторметоксицинаміл	CF	CH	CH
I-31	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CH	CH
I-32	4-метоксицинаміл	CF	CH	CH
I-33	4-етоксицинаміл	CF	CH	CH
I-34	4-ціаноцинаміл	CF	CH	CH
I-35	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CH	CH
I-36	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CH	CH
I-37	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CH	CH
I-38	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CH	CH
I-39	3,5-дихлорцинаміл	CF	CH	CH
I-40	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CH	CH
I-41	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CH	CH
I-42	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CH	CH
I-43	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH	CH
I-44	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH	CH
I-45	3-піридин-4-ілаліл	CF	CH	CH

I-46	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CH	CH
I-47	4-хлорбензил	CCl	CH	CH
I-48	цинаміл	CCl	CH	CH
I-49	4-хлорцинаміл	CCl	CH	CH
I-50	4-фторцинаміл	CCl	CH	CH
I-51	4-бромцинаміл	CCl	CH	CH
I-52	4-трифторметилцинаміл	CCl	CH	CH
I-53	4-трифторметоксицинаміл	CCl	CH	CH
I-54	4-пентафторетоксицинаміл	CCl	CH	CH
I-55	4-метоксицинаміл	CCl	CH	CH
I-56	4-етоксицинаміл	CCl	CH	CH
I-57	4-ціаноцинаміл	CCl	CH	CH
I-58	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCl	CH	CH
I-59	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCl	CH	CH
I-60	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCl	CH	CH
I-61	3-хлор-4-фторцинаміл	CCl	CH	CH
I-62	3,5-дихлорцинаміл	CCl	CH	CH
I-63	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCl	CH	CH
I-64	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCl	CH	CH
I-65	3-нафталін-2-ілаліл	CCl	CH	CH
I-66	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCl	CH	CH
I-67	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCl	CH	CH
I-68	3-піридин-4-ілаліл	CCl	CH	CH
I-69	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCl	CH	CH
I-70	4-хлорбензил	CBr	CH	CH
I-71	цинаміл	CBr	CH	CH
I-72	4-хлорцинаміл	CBr	CH	CH
I-73	4-фторцинаміл	CBr	CH	CH
I-74	4-бромцинаміл	CBr	CH	CH
I-75	4-трифторметилцинаміл	CBr	CH	CH
I-76	4-трифторметоксицинаміл	CBr	CH	CH
I-77	4-пентафторетоксицинаміл	CBr	CH	CH
I-78	4-метоксицинаміл	CBr	CH	CH
I-79	4-етоксицинаміл	CBr	CH	CH
I-80	4-ціаноцинаміл	CBr	CH	CH
I-81	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CBr	CH	CH
I-82	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CBr	CH	CH
I-83	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CBr	CH	CH
I-84	3-хлор-4-фторцинаміл	CBr	CH	CH
I-85	3,5-дихлорцинаміл	CBr	CH	CH
I-86	5-фенілпента-2,4-дієніл	CBr	CH	CH
I-87	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CBr	CH	CH
I-88	3-нафталін-2-ілаліл	CBr	CH	CH
I-89	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CBr	CH	CH
I-90	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CBr	CH	CH
I-91	3-піридин-4-ілаліл	CBr	CH	CH
I-92	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CBr	CH	CH
I-93	4-хлорбензил	CCN	CH	CH
I-94	цинаміл	CCN	CH	CH
I-95	4-хлорцинаміл	CCN	CH	CH
I-96	4-фторцинаміл	CCN	CH	CH
I-97	4-бромцинаміл	CCN	CH	CH
I-98	4-трифторметилцинаміл	CCN	CH	CH
I-99	4-трифторметоксицинаміл	CCN	CH	CH
I-100	4-пентафторетоксицинаміл	CCN	CH	CH
I-101	4-метоксицинаміл	CCN	CH	CH
I-102	4-етоксицинаміл	CCN	CH	CH
I-103	4-ціаноцинаміл	CCN	CH	CH
I-104	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCN	CH	CH
I-105	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCN	CH	CH
I-106	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCN	CH	CH

I-107	3-хлор-4-фторцинаміл	CCN	CH	CH
I-108	3,5-дихлорцинаміл	CCN	CH	CH
I-109	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCN	CH	CH
I-110	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCN	CH	CH
I-111	3-нафталін-2-ілаліл	CCN	CH	CH
I-112	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCN	CH	CH
I-113	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCN	CH	CH
I-114	3-піридин-4-ілаліл	CCN	CH	CH
I-115	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCN	CH	CH
I-116	4-хлорбензил	COMe	CH	CH
I-117	цинаміл	COMe	CH	CH
I-118	4-хлорцинаміл	COMe	CH	CH
I-119	4-фторцинаміл	COMe	CH	CH
I-120	4-бромцинаміл	COMe	CH	CH
I-121	4-трифторметилцинаміл	COMe	CH	CH
I-122	4-трифторметоксицинаміл	COMe	CH	CH
I-123	4-пентафторетоксицинаміл	COMe	CH	CH
I-124	4-метоксицинаміл	COMe	CH	CH
I-125	4-етоксицинаміл	COMe	CH	CH
I-126	4-ціаноцинаміл	COMe	CH	CH
I-127	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COMe	CH	CH
I-128	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COMe	CH	CH
I-129	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COMe	CH	CH
I-130	3-хлор-4-фторцинаміл	COMe	CH	CH
I-131	3,5-дихлорцинаміл	COMe	CH	CH
I-132	5-фенілпента-2,4-дієніл	COMe	CH	CH
I-133	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COMe	CH	CH
I-134	3-нафталін-2-ілаліл	COMe	CH	CH
I-135	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COMe	CH	CH
I-136	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COMe	CH	CH
I-137	3-піридин-4-ілаліл	COMe	CH	CH
I-138	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COMe	CH	CH
I-139	4-хлорбензил	COCF ₃	CH	CH
I-140	цинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-141	4-хлорцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-142	4-фторцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-143	4-бромцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-144	4-трифторметилцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-145	4-трифторметоксицинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-146	4-пентафторетоксицинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-147	4-метоксицинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-148	4-етоксицинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-149	4-ціаноцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-150	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COCF ₃	CH	CH
I-151	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COCF ₃	CH	CH
I-152	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COCF ₃	CH	CH
I-153	3-хлор-4-фторцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-154	3,5-дихлорцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-155	5-фенілпента-2,4-дієніл	COCF ₃	CH	CH
I-156	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COCF ₃	CH	CH
I-157	3-нафталін-2-ілаліл	COCF ₃	CH	CH
I-158	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COCF ₃	CH	CH
I-159	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COCF ₃	CH	CH
I-160	3-піридин-4-ілаліл	COCF ₃	CH	CH
I-161	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COCF ₃	CH	CH
I-162	4-хлорбензил	CCH ₃	CH	CH
I-163	цинаміл	CCH ₃	CH	CH
I-164	4-хлорцинаміл	CCH ₃	CH	CH
I-165	4-фторцинаміл	CCH ₃	CH	CH
I-166	4-бромцинаміл	CCH ₃	CH	CH
I-167	4-трифторметилцинаміл	CCH ₃	CH	CH

I-168	4-трифторметоксицинаміл	CCH_3	CH	CH
I-169	4-пентафторетоксицинаміл	CCH_3	CH	CH
I-170	4-метоксицинаміл	CCH_3	CH	CH
I-171	4-етоксицинаміл	CCH_3	CH	CH
I-172	4-ціаноцинаміл	CCH_3	CH	CH
I-173	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCH_3	CH	CH
I-174	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCH_3	CH	CH
I-175	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCH_3	CH	CH
I-176	3-хлор-4-фторцинаміл	CCH_3	CH	CH
I-177	3,5-дихлорцинаміл	CCH_3	CH	CH
I-178	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCH_3	CH	CH
I-179	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCH_3	CH	CH
I-180	3-нафталін-2-ілаліл	CCH_3	CH	CH
I-181	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCH_3	CH	CH
I-182	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCH_3	CH	CH
I-183	3-піридин-4-ілаліл	CCH_3	CH	CH
I-184	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCH_3	CH	CH
I-185	4-хлорбензил	CCF_3	CH	CH
I-186	цинаміл	CCF_3	CH	CH
I-187	4-хлорцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-188	4-фторцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-189	4-бромцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-190	4-трифторметилцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-191	4-трифторметоксицинаміл	CCF_3	CH	CH
I-192	4-пентафторетоксицинаміл	CCF_3	CH	CH
I-193	4-метоксицинаміл	CCF_3	CH	CH
I-194	4-етоксицинаміл	CCF_3	CH	CH
I-195	4-ціаноцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-196	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCF_3	CH	CH
I-197	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCF_3	CH	CH
I-198	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCF_3	CH	CH
I-199	3-хлор-4-фторцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-200	3,5-дихлорцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-201	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCF_3	CH	CH
I-202	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCF_3	CH	CH
I-203	3-нафталін-2-ілаліл	CCF_3	CH	CH
I-204	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCF_3	CH	CH
I-205	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCF_3	CH	CH
I-206	3-піридин-4-ілаліл	CCF_3	CH	CH
I-207	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCF_3	CH	CH
I-208	4-хлорбензил	CH	CCl	CH
I-209	цинаміл	CH	CCl	CH
I-210	4-хлорцинаміл	CH	CCl	CH
I-211	4-фторцинаміл	CH	CCl	CH
I-212	4-бромцинаміл	CH	CCl	CH
I-213	4-трифторметилцинаміл	CH	CCl	CH
I-214	4-трифторметоксицинаміл	CH	CCl	CH
I-215	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CCl	CH
I-216	4-метоксицинаміл	CH	CCl	CH
I-217	4-етоксицинаміл	CH	CCl	CH
I-218	4-ціаноцинаміл	CH	CCl	CH
I-219	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CCl	CH
I-220	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CCl	CH
I-221	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CCl	CH
I-222	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CCl	CH
I-223	3,5-дихлорцинаміл	CH	CCl	CH
I-224	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CCl	CH
I-225	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CCl	CH
I-226	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CCl	CH
I-227	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCl	CH
I-228	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCl	CH

I-229	3-піридин-4-ілаліл	CH	CCl	CH
I-230	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CCl	CH
I-231	4-хлорбензил	CH	CF	CH
I-232	цинаміл	CH	CF	CH
I-233	4-хлорцинаміл	CH	CF	CH
I-234	4-фторцинаміл	CH	CF	CH
I-235	4-бромцинаміл	CH	CF	CH
I-236	4-трифторметилцинаміл	CH	CF	CH
I-237	4-трифторметоксицинаміл	CH	CF	CH
I-238	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CF	CH
I-239	4-метоксицинаміл	CH	CF	CH
I-240	4-етоксицинаміл	CH	CF	CH
I-241	4-ціаноцинаміл	CH	CF	CH
I-242	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CF	CH
I-243	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CF	CH
I-244	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CF	CH
I-245	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CF	CH
I-246	3,5-дихлорцинаміл	CH	CF	CH
I-247	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CF	CH
I-248	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CF	CH
I-249	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CF	CH
I-250	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CF	CH
I-251	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CF	CH
I-252	3-піридин-4-ілаліл	CH	CF	CH
I-253	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CF	CH
I-254	4-хлорбензил	CH	CBr	CH
I-255	цинаміл	CH	CBr	CH
I-256	4-хлорцинаміл	CH	CBr	CH
I-257	4-фторцинаміл	CH	CBr	CH
I-258	4-бромцинаміл	CH	CBr	CH
I-259	4-трифторметилцинаміл	CH	CBr	CH
I-260	4-трифторметоксицинаміл	CH	CBr	CH
I-261	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CBr	CH
I-262	4-метоксицинаміл	CH	CBr	CH
I-263	4-етоксицинаміл	CH	CBr	CH
I-264	4-ціаноцинаміл	CH	CBr	CH
I-265	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CBr	CH
I-266	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CBr	CH
I-267	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CBr	CH
I-268	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CBr	CH
I-269	3,5-дихлорцинаміл	CH	CBr	CH
I-270	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CBr	CH
I-271	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CBr	CH
I-272	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CBr	CH
I-273	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CBr	CH
I-274	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CBr	CH
I-275	3-піридин-4-ілаліл	CH	CBr	CH
I-276	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CBr	CH
I-277	4-хлорбензил	CH	COCF ₃	CH
I-278	цинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-279	4-хлорцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-280	4-фторцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-281	4-бромцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-282	4-трифторметилцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-283	4-трифторметоксицинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-284	4-пентафторетоксицинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-285	4-метоксицинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-286	4-етоксицинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-287	4-ціаноцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-288	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	COCF ₃	CH
I-289	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	COCF ₃	CH

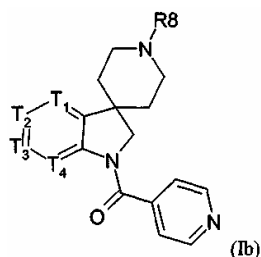
I-290	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	COCF ₃	CH
I-291	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-292	3,5-дихлорцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-293	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	COCF ₃	CH
I-294	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	COCF ₃	CH
I-295	3-нафталін-2-ілаліл	CH	COCF ₃	CH
I-296	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	COCF ₃	CH
I-297	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	COCF ₃	CH
I-298	3-піридин-4-ілаліл	CH	COCF ₃	CH
I-299	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	COCF ₃	CH
I-300	4-хлорбензил	CH	CCH ₃	CH
I-301	цинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-302	4-хлорцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-303	4-фторцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-304	4-бромцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-305	4-трифторметилцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-306	4-трифторметоксицинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-307	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-308	4-метоксицинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-309	4-етоксицинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-310	4-ціаноцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-311	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CCH ₃	CH
I-312	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CCH ₃	CH
I-313	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CCH ₃	CH
I-314	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-315	3,5-дихлорцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-316	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CCH ₃	CH
I-317	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CCH ₃	CH
I-318	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CCH ₃	CH
I-319	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCH ₃	CH
I-320	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCH ₃	CH
I-321	3-піридин-4-ілаліл	CH	CCH ₃	CH
I-322	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CCH ₃	CH
I-323	4-хлорбензил	CH	CCF ₃	CH
I-324	цинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-325	4-хлорцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-326	4-фторцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-327	4-бромцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-328	4-трифторметилцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-329	4-трифторметоксицинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-330	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-331	4-метоксицинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-332	4-етоксицинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-333	4-ціаноцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-334	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CCF ₃	CH
I-335	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CCF ₃	CH
I-336	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CCF ₃	CH
I-337	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-338	3,5-дихлорцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-339	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CCF ₃	CH
I-340	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CCF ₃	CH
I-341	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CCF ₃	CH
I-342	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCF ₃	CH
I-343	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCF ₃	CH
I-344	3-піридин-4-ілаліл	CH	CCF ₃	CH
I-345	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CCF ₃	CH
I-346	4-хлорбензил	CH	CH	CF
I-347	цинаміл	CH	CH	CF
I-348	4-хлорцинаміл	CH	CH	CF
I-349	4-фторцинаміл	CH	CH	CF
I-350	4-бромцинаміл	CH	CH	CF

I-351	4-трифторметилцинаміл	CH	CH	CF
I-352	4-трифторметоксицинаміл	CH	CH	CF
I-353	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CH	CF
I-354	4-метоксицинаміл	CH	CH	CF
I-355	4-етоксицинаміл	CH	CH	CF
I-356	4-ціаноцинаміл	CH	CH	CF
I-357	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CH	CF
I-358	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CH	CF
I-359	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CH	CF
I-360	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CH	CF
I-361	3,5-дихлорцинаміл	CH	CH	CF
I-362	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CH	CF
I-363	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CH	CF
I-364	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CH	CF
I-365	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CF
I-366	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CF
I-367	3-піридин-4-ілаліл	CH	CH	CF
I-368	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CH	CF
I-369	4-хлорбензил	CH	CH	CCI
I-370	цинаміл	CH	CH	CCI
I-371	4-хлорцинаміл	CH	CH	CCI
I-372	4-фторцинаміл	CH	CH	CCI
I-373	4-бромцинаміл	CH	CH	CCI
I-374	4-трифторметилцинаміл	CH	CH	CCI
I-375	4-трифторметоксицинаміл	CH	CH	CCI
I-376	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CH	CCI
I-377	4-метоксицинаміл	CH	CH	CCI
I-378	4-етоксицинаміл	CH	CH	CCI
I-379	4-ціаноцинаміл	CH	CH	CCI
I-380	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CH	CCI
I-381	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CH	CCI
I-382	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CH	CCI
I-383	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CH	CCI
I-384	3,5-дихлорцинаміл	CH	CH	CCI
I-385	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CH	CCI
I-386	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CH	CCI
I-387	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CH	CCI
I-388	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CCI
I-389	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH	CCI
I-390	3-піридин-4-ілаліл	CH	CH	CCI
I-391	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CH	CCI
I-438	4-хлорбензил	CCI	CH	CCI
I-439	цинаміл	CCI	CH	CCI
I-440	4-хлорцинаміл	CCI	CH	CCI
I-441	4-фторцинаміл	CCI	CH	CCI
I-442	4-бромцинаміл	CCI	CH	CCI
I-443	4-трифторметилцинаміл	CCI	CH	CCI
I-444	4-трифторметоксицинаміл	CCI	CH	CCI
I-445	4-пентафторетоксицинаміл	CCI	CH	CCI
I-446	4-метоксицинаміл	CCI	CH	CCI
I-447	4-етоксицинаміл	CCI	CH	CCI
I-448	4-ціаноцинаміл	CCI	CH	CCI
I-449	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCI	CH	CCI
I-450	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCI	CH	CCI
I-451	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCI	CH	CCI
I-452	3-хлор-4-фторцинаміл	CCI	CH	CCI
I-453	3,5-дихлорцинаміл	CCI	CH	CCI
I-454	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCI	CH	CCI
I-455	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCI	CH	CCI
I-456	3-нафталін-2-ілаліл	CCI	CH	CCI
I-457	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CH	CCI

I-458	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CH	CCI
I-459	3-піридин-4-ілаліл	CCI	CH	CCI
I-460	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCI	CH	CCI
I-461	4-хлорбензил	CF	CH	CF
I-462	цинаміл	CF	CH	CF
I-463	4-хлорцинаміл	CF	CH	CF
I-464	4-фторцинаміл	CF	CH	CF
I-465	4-бромцинаміл	CF	CH	CF
I-466	4-трифторметилцинаміл	CF	CH	CF
I-467	4-трифторметоксицинаміл	CF	CH	CF
I-468	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CH	CF
I-469	4-метоксицинаміл	CF	CH	CF
I-470	4-етоксицинаміл	CF	CH	CF
I-471	4-ціаноцинаміл	CF	CH	CF
I-472	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CH	CF
I-473	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CH	CF
I-474	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CH	CF
I-475	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CH	CF
I-476	3,5-дихлорцинаміл	CF	CH	CF
I-477	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CH	CF
I-478	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CH	CF
I-479	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CH	CF
I-480	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH	CF
I-481	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH	CF
I-482	3-піридин-4-ілаліл	CF	CH	CF
I-483	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CH	CF
I-484	4-хлорбензил	CF	CF	CH
I-485	цинаміл	CF	CF	CH
I-486	4-хлорцинаміл	CF	CF	CH
I-487	4-фторцинаміл	CF	CF	CH
I-488	4-бромцинаміл	CF	CF	CH
I-489	4-трифторметилцинаміл	CF	CF	CH
I-490	4-трифторметоксицинаміл	CF	CF	CH
I-491	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CF	CH
I-492	4-метоксицинаміл	CF	CF	CH
I-493	4-етоксицинаміл	CF	CF	CH
I-494	4-ціаноцинаміл	CF	CF	CH
I-495	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CF	CH
I-496	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CF	CH
I-497	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CF	CH
I-498	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CF	CH
I-499	3,5-дихлорцинаміл	CF	CF	CH
I-500	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CF	CH
I-501	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CF	CH
I-502	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CF	CH
I-503	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CF	CH
I-504	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CF	CH
I-505	3-піридин-4-ілаліл	CF	CF	CH
I-506	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CF	CH
I-507	4-хлорбензил	CF	CCI	CH
I-508	цинаміл	CF	CCI	CH
I-509	4-хлорцинаміл	CF	CCI	CH
I-510	4-фторцинаміл	CF	CCI	CH
I-511	4-бромцинаміл	CF	CCI	CH
I-512	4-трифторметилцинаміл	CF	CCI	CH
I-513	4-трифторметоксицинаміл	CF	CCI	CH
I-514	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CCI	CH
I-515	4-метоксицинаміл	CF	CCI	CH
I-516	4-етоксицинаміл	CF	CCI	CH
I-517	4-ціаноцинаміл	CF	CCI	CH
I-518	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CCI	CH

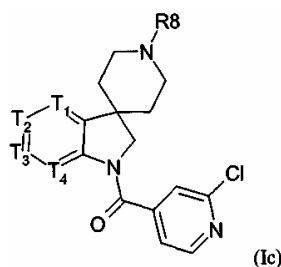
I-519	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CCI	CH
I-520	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CCI	CH
I-521	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CCI	CH
I-522	3,5-дихлорцинаміл	CF	CCI	CH
I-523	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CCI	CH
I-524	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CCI	CH
I-525	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CCI	CH
I-526	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CCI	CH
I-527	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CCI	CH
I-528	3-піридин-4-ілаліл	CF	CCI	CH
I-529	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CCI	CH
I-530	4-хлорбензил	CCI	CF	CH
I-531	цинаміл	CCI	CF	CH
I-532	4-хлорцинаміл	CCI	CF	CH
I-533	4-фторцинаміл	CCI	CF	CH
I-534	4-бромцинаміл	CCI	CF	CH
I-535	4-трифторметилцинаміл	CCI	CF	CH
I-536	4-трифторметоксицинаміл	CCI	CF	CH
I-537	4-пентафторетоксицинаміл	CCI	CF	CH
I-538	4-метоксицинаміл	CCI	CF	CH
I-539	4-етоксицинаміл	CCI	CF	CH
I-540	4-ціаноцинаміл	CCI	CF	CH
I-541	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCI	CF	CH
I-542	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCI	CF	CH
I-543	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCI	CF	CH
I-544	3-хлор-4-фторцинаміл	CCI	CF	CH
I-545	3,5-дихлорцинаміл	CCI	CF	CH
I-546	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCI	CF	CH
I-547	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCI	CF	CH
I-548	3-нафталін-2-ілаліл	CCI	CF	CH
I-549	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CF	CH
I-550	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CF	CH
I-551	3-піридин-4-ілаліл	CCI	CF	CH
I-552	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCI	CF	CH
I-553	4-хлорбензил	CCI	CCI	CH
I-554	цинаміл	CCI	CCI	CH
I-555	4-хлорцинаміл	CCI	CCI	CH
I-556	4-фторцинаміл	CCI	CCI	CH
I-557	4-бромцинаміл	CCI	CCI	CH
I-558	4-трифторметилцинаміл	CCI	CCI	CH
I-559	4-трифторметоксицинаміл	CCI	CCI	CH
I-560	4-пентафторетоксицинаміл	CCI	CCI	CH
I-561	4-метоксицинаміл	CCI	CCI	CH
I-562	4-етоксицинаміл	CCI	CCI	CH
I-563	4-ціаноцинаміл	CCI	CCI	CH
I-564	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCI	CCI	CH
I-565	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCI	CCI	CH
I-566	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCI	CCI	CH
I-567	3-хлор-4-фторцинаміл	CCI	CCI	CH
I-568	3,5-дихлорцинаміл	CCI	CCI	CH
I-569	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCI	CCI	CH
I-570	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCI	CCI	CH
I-571	3-нафталін-2-ілаліл	CCI	CCI	CH
I-572	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CCI	CH
I-573	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CCI	CH
I-574	3-піридин-4-ілаліл	CCI	CCI	CH
I-575	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCI	CCI	CH

У таблиці II наведено 575 сполук формули Ib



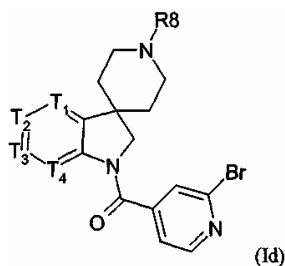
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці III наведено 575 сполук формули Ic



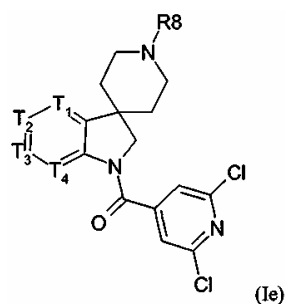
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці IV наведено 575 сполук формули Id



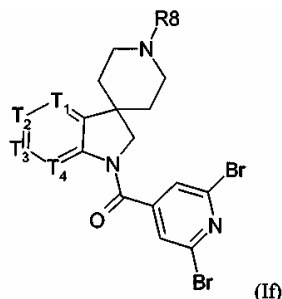
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці V наведено 575 сполук формули Ie



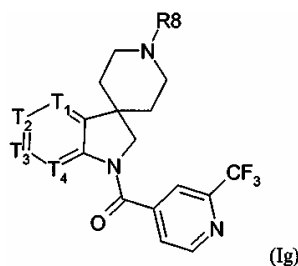
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці VI наведено 575 сполук формули If



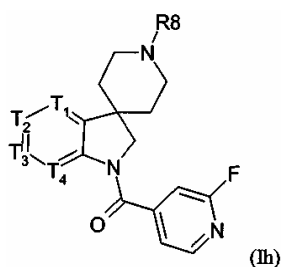
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці VII наведено 575 сполук формули Ig



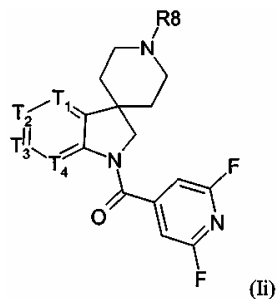
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці VIII наведено 575 сполук формули Ih



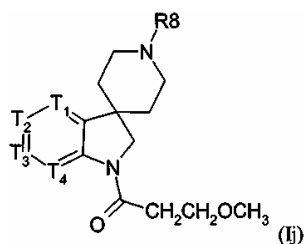
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці IX наведено 575 сполук формули Ii



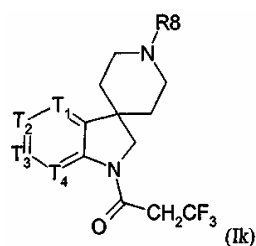
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці X наведено 575 сполук формули Ij



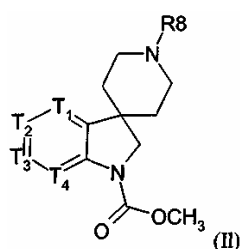
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XI наведено 575 сполук формули Ік



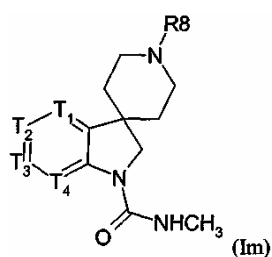
у якій $T1$ означає N , $T2$ означає CR^{4a} , $T3$ означає CR^{4b} , $T4$ означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XII наведено 575 сполук формули II



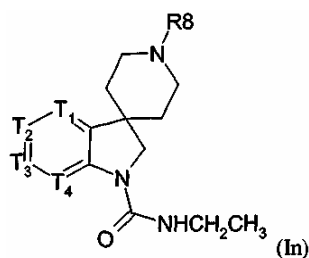
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XIII наведено 575 сполук формули



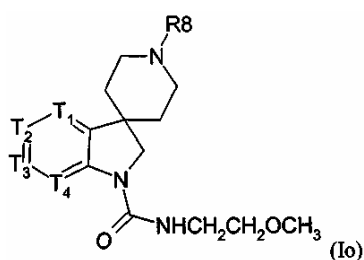
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XIV наведено 575 сполук формули



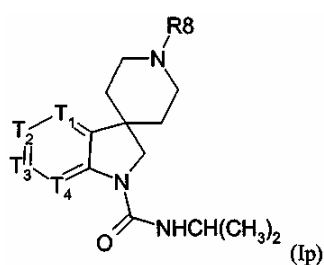
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XV наведено 575 сполук формули Іо



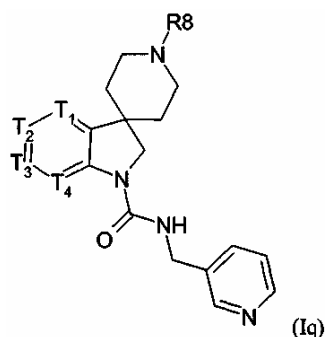
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVI наведено 575 сполук формули



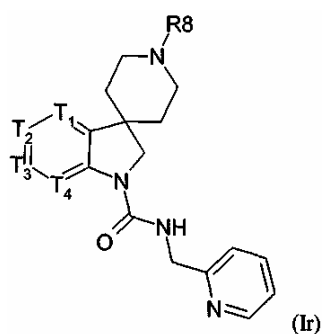
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVII наведено 575 сполук формули



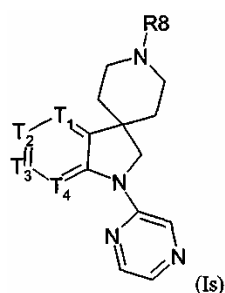
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XVIII наведено 575 сполук формули



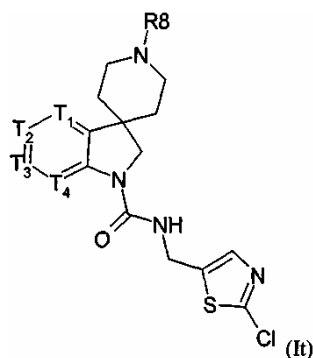
у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XIX наведено 575 сполук формули Is



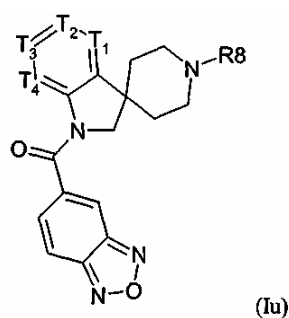
у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XX наведено 575 сполук формули It



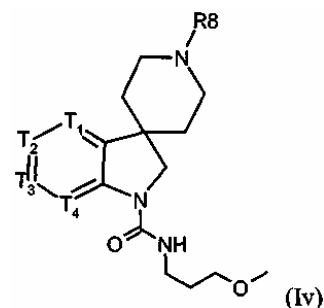
у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXI наведено 575 сполук формули Iu



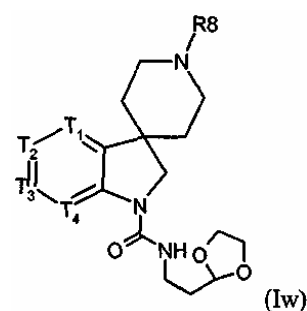
у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXII наведено 575 сполук формули Iv



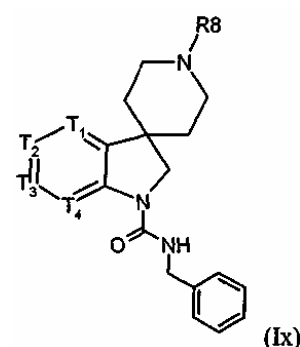
у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXIII наведено 575 сполук формули Iw



у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

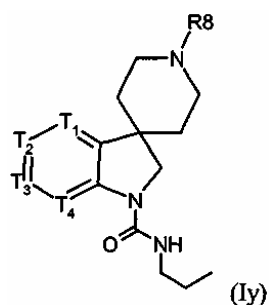
У таблиці XXIV наведено 575 сполук формули Ix



у якій T₁ означає N, T₂ означає CR^{4a}, T₃ означає CR^{4b}, T₄ означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

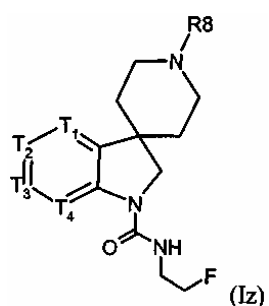
У таблиці XXV наведено 575 сполук формули Iy

51



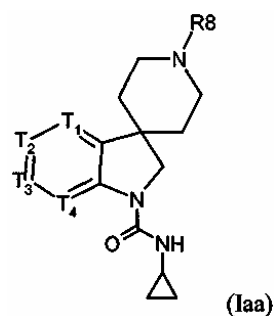
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVI наведено 575 сполук формули Iz



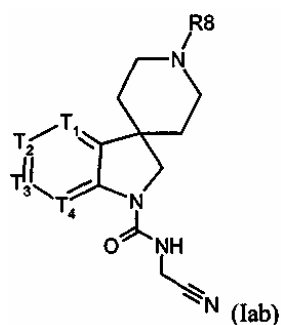
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVII наведено 575 сполук формули Iaa



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXVIII наведено 575 сполук формули Iab

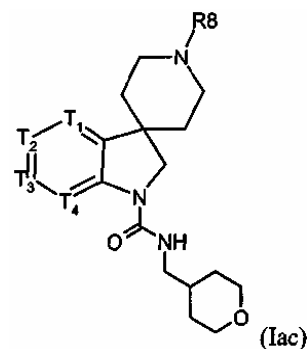


87480

52

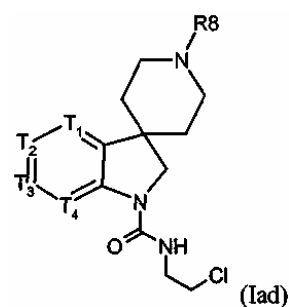
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXIX наведено 575 сполук формули Iac



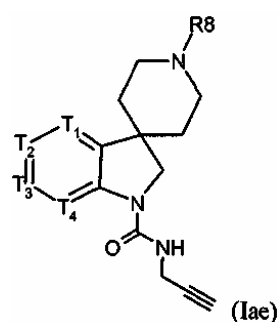
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXX наведено 575 сполук формули Iad



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

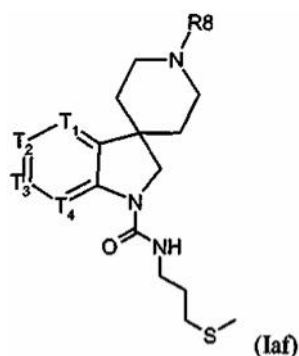
У таблиці XXXI наведено 575 сполук формули Iae



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

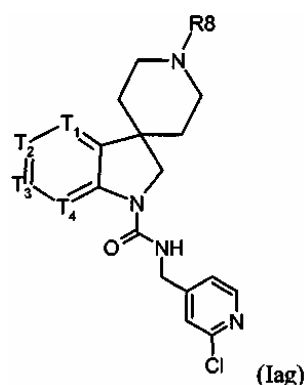
У таблиці XXXII наведено 575 сполук формули Iaf

53



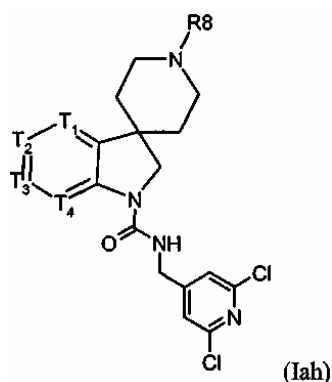
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXXIII наведено 575 сполук формули Iag



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXXIV наведено 575 сполук формули Iah

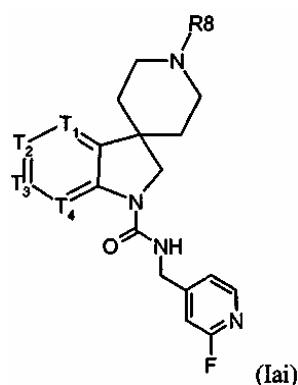


у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXXV наведено 575 сполук формули Iai

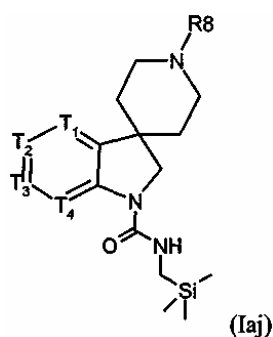
87480

54



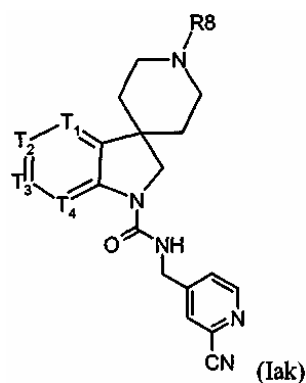
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXXVI наведено 575 сполук формули Iaj



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

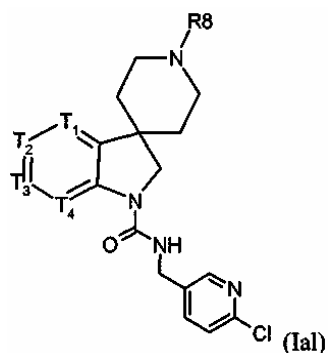
У таблиці XXXVII наведено 575 сполук формули Iak



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

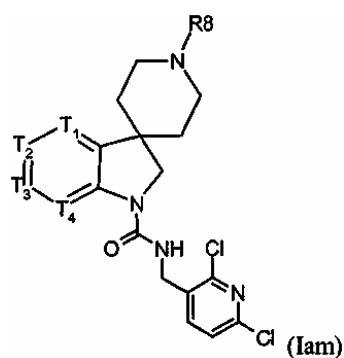
У таблиці XXXVIII наведено 575 сполук формули Ial

55



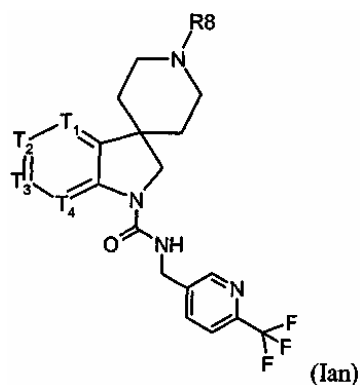
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XXXIX наведено 575 сполук формули Iam



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLX наведено 575 сполук формули Ian

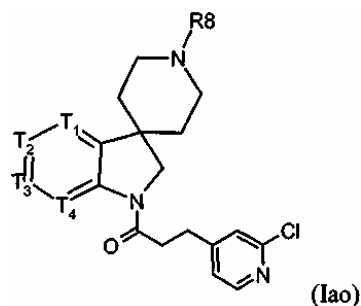


у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLI наведено 575 сполук формули Iao

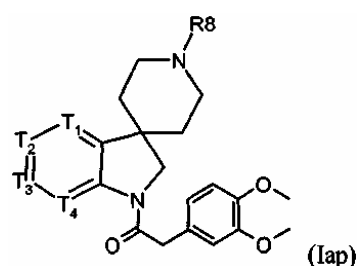
87480

56



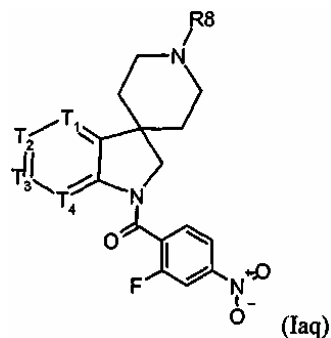
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLII наведено 575 сполук формули Iap



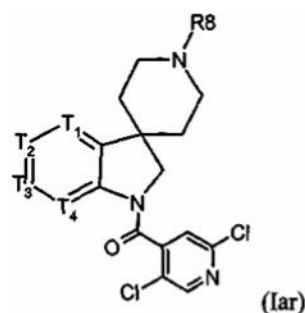
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLIII наведено 575 сполук формули Iaq



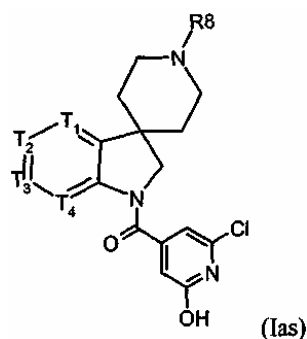
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLIV наведено 575 сполук формули Iar



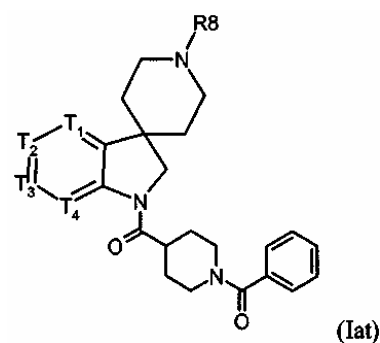
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLV наведено 575 сполук формули Ias



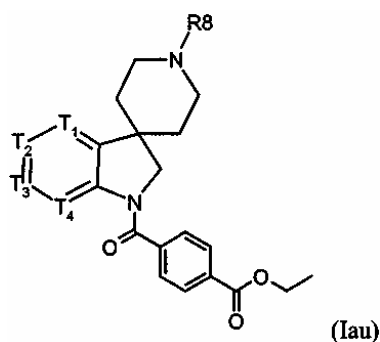
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLV наведено 575 сполук формули Iat



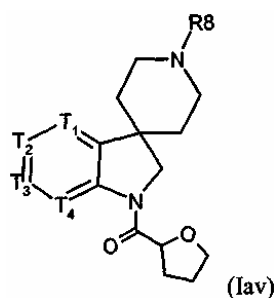
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLVII наведено 575 сполук формули Iau



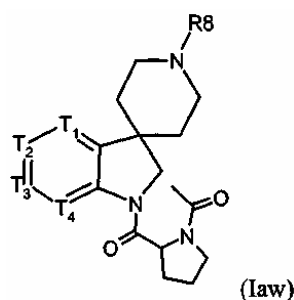
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці XLVIII наведено 575 сполук формули Iav



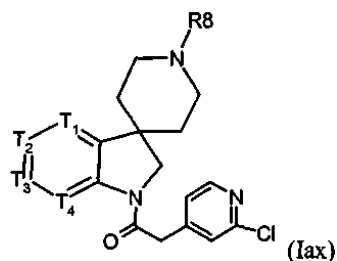
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці IL наведено 575 сполук формули Iaw



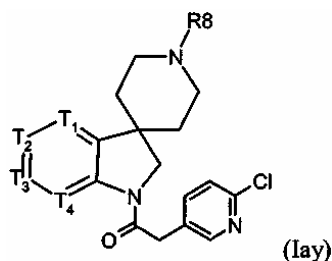
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці L наведено 575 сполук формули Iax



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

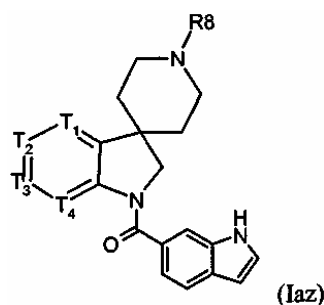
У таблиці LI наведено 575 сполук формули Iay



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

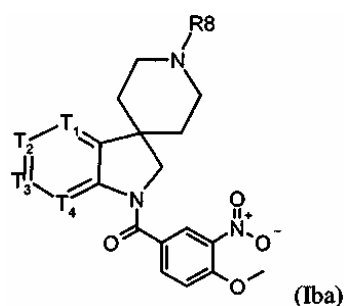
У таблиці LII наведено 575 сполук формули Iaz

59



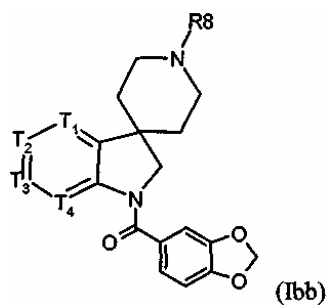
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LIII наведено 575 сполук формули Iba



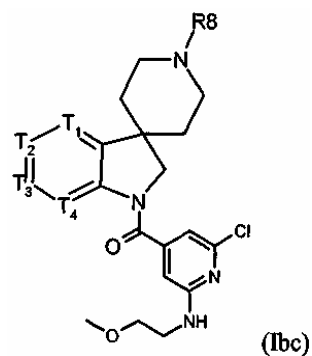
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LIV наведено 575 сполук формули Ibb



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LV наведено 575 сполук формули Ibc

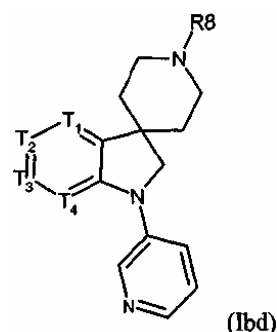


87480

60

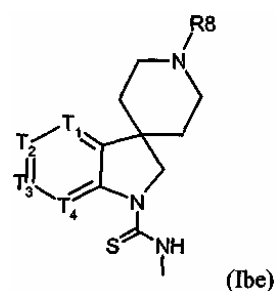
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LVI наведено 575 сполук формули Ibd



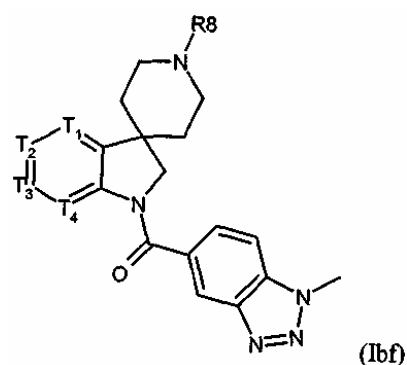
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LVII наведено 575 сполук формули Ibe



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

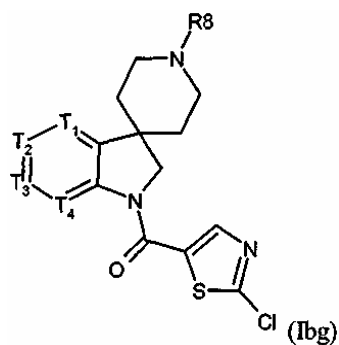
У таблиці LVIII наведено 575 сполук формули Ibf



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

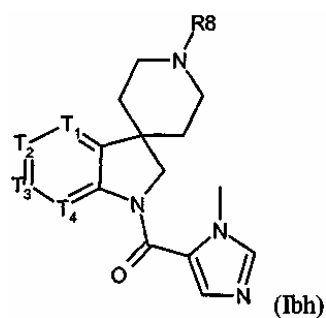
У таблиці LIX наведено 575 сполук формули Ibg

61



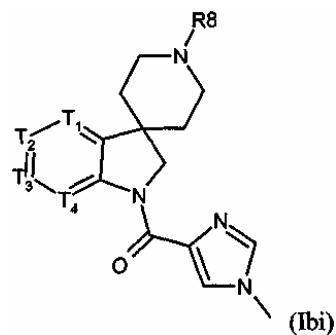
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LX наведено 575 сполук формули Ibh



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LXI наведено 575 сполук формули Ibi

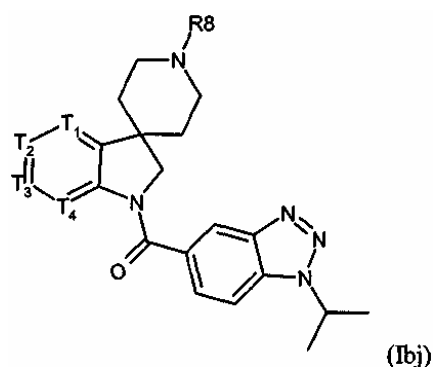


у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LXII наведено 575 сполук формули Ibj

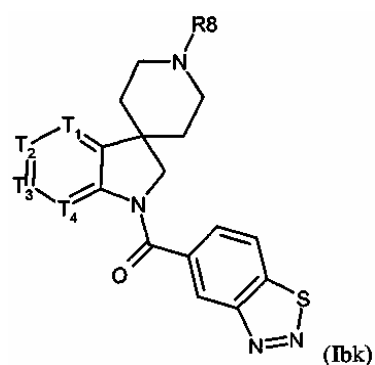
87480

62



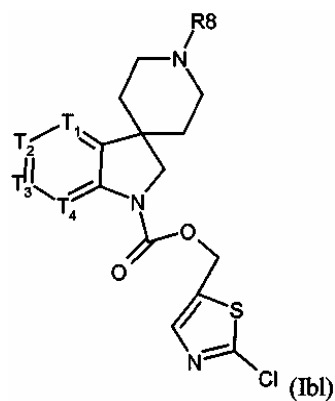
у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LXIII наведено 575 сполук формули Ibk



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LXIV наведено 575 сполук формули Ibl



у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці LXV наведено 575 сполук формули Ibm

У таблиці CXXXVI наведено 575 сполук формули Iaj, у якій T1 означає CR^{4b}, T2 означає N, T3

У таблиці CLII наведено 575 сполук формули Iaz, у якій T1 означає CR^{4b} , T2 означає N, T3 означає CR^{4a} , T4 означає CR^{4c} і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCXXXV наведено 575 сполук формули Iai, у якій T1 означає CR^{4b}, T2 означає CR^{4a},

У таблиці CCL1 наведено 575 сполук формули, у якій T1 означає CR^{4b}, T2 означає CR^{4a}, T3 означає N, T4 означає CR^{4c} і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCXXXIV наведено 575 сполук формули Iah, у якій T1 означає CR^{4c}, T2 означає

У таблиці CCCL наведено 575 сполук формули Iах, у якій T1 означає CR^{4c}, T2 означає CR^{4a}, T3 означає CR^{4b}, T4 означає N і значення R⁸, R^{4a}, R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLI наведено 575 сполук формули, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLII наведено 575 сполук формули Iaz, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLIII наведено 575 сполук формули Iba, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLIV наведено 575 сполук формули Ibb, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLV наведено 575 сполук формули Ibc, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLVI наведено 575 сполук формули Ibd, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLVII наведено 575 сполук формули Ibe, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLVIII наведено 575 сполук формули Ibf, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLIX наведено 575 сполук формули Ibg, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLX наведено 575 сполук формули Ibh, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXI наведено 575 сполук формули Ibi, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXII наведено 575 сполук формули Ibj, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXIII наведено 575 сполук формули Ibk, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXIV наведено 575 сполук формули Ibl, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXV наведено 575 сполук формули Ibm, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXVI наведено 575 сполук формули Ibp, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CCCLXVII наведено 575 сполук формули Ibo, у якій T1 означає CR^{4c} , T2 означає CR^{4a} , T3 означає CR^{4b} , T4 означає N і значення R^8 , R^{4a} , R^{4b} й R^{4c} наведені в таблиці 1.

У таблиці CDI наведено 345 сполук формули Ia, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e} , T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R^8 , R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

Таблиця 2

Сполука №	R^8	$C-R^{4e}$	$C-R^{4f}$
CDI-1	4-хлорбензил	CH	CH
CD1-2	цинаміл	CH	CH
CD1-C3	4-хлорцинаміл	CH	CH
CD1-C4	4-фторцинаміл	CH	CH
CD1-5	4-бромцинаміл	CH	CH
CD1-C6	4-трифторметилцинаміл	CH	CH
CD1-7	4-трифторметоксицинаміл	CH	CH
CD1-C8	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CH
CD1-9	4-метоксицинаміл	CH	CH
CD1-C10	4-етоксицинаміл	CH	CH
CD1-11	4-ціаноцинаміл	CH	CH
CD1-12	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CH
CD1-13	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CH
CD1-14	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CH
CD1-15	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CH
CD1-16	3,5-дихлорцинаміл	CH	CH
CD1-17	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CH
CD1-18	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CH
CD1-19	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CH
CD1-20	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH
CD1-21	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CH
CD1-22	3-піридин-4-ілаліл	CH	CH
CD1-23	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CH

CD1-24	4-хлорбензил	CF	CH
CD1-25	цинаміл	CF	CH
CD1-26	4-хлорцинаміл	CF	CH
CD1-27	4-фторцинаміл	CF	CH
CD1-28	4-бромцинаміл	CF	CH
CD1-29	4-трифторметилцинаміл	CF	CH
CD1-C30	4-трифторметоксицинаміл	CF	CH
CD1-C31	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CH
CD1-C32	4-метоксицинаміл	CF	CH
CD1-C33	4-етоксицинаміл	CF	CH
CD1-C34	4-ціаноцинаміл	CF	CH
CD1-C35	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CH
CD1-C36	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CH
CD1-C37	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CH
CD1-C38	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CH
CD1-C39	3,5-дихлорцинаміл	CF	CH
CD1-C40	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CH
CD1-C41	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CH
CD1-C42	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CH
CD1-C43	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH
CD1-C44	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CH
CD1-C45	3-піридин-4-ілаліл	CF	CH
CD1-C46	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CH
CD1-C47	4-хлорбензил	CCl	CH
CD1-C48	цинаміл	CCl	CH
CD1-C49	4-хлорцинаміл	CCl	CH
CD1-50	4-фторцинаміл	CCl	CH
CD1-51	4-бромцинаміл	CCl	CH
CD1-52	4-трифторметилцинаміл	CCl	CH
CD1-53	4-трифторметоксицинаміл	CCl	CH
CD1-54	4-пентафторетоксицинаміл	CCl	CH
CD1-55	4-метоксицинаміл	CCl	CH
CD1-56	4-етоксицинаміл	CCl	CH
CD1-57	4-ціаноцинаміл	CCl	CH
CD1-58	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCl	CH
CD1-59	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCl	CH
CD1-C60	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCl	CH
CD1-C61	3-хлор-4-фторцинаміл	CCl	CH
CD1-C62	3,5-дихлорцинаміл	CCl	CH
CD1-C63	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCl	CH
CD1-C64	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCl	CH
CD1-C65	3-нафталін-2-ілаліл	CCl	CH
CD1-C66	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCl	CH
CD1-C67	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCl	CH
CD1-C68	3-піридин-4-ілаліл	CCl	CH
CD1-C69	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCl	CH
CD1-70	4-хлорбензил	CBr	CH
CD1-71	цинаміл	CBr	CH
CD1-72	4-хлорцинаміл	CBr	CH
CD1-73	4-фторцинаміл	CBr	CH
CD1-74	4-бромцинаміл	CBr	CH
CD1-75	4-трифторметилцинаміл	CBr	CH
CD1-76	4-трифторметоксшцинаміл	CBr	CH
CD1-77	4-пентафторетоксицинаміл	CBr	CH
CD1-78	4-метоксицинаміл	CBr	CH
CD1-79	4-етоксицинаміл	CBr	CH
CD1-C80	4-ціаноцинаміл	CBr	CH
CD1-C81	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CBr	CH
CD1-C82	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CBr	CH
CD1-C83	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CBr	CH
CD1-C84	3-хлор-4-фторцинаміл	CBr	CH

CD1-C85	3,5-дихлорцинаміл	CBr	CH
CD1-C86	5-фенілпента-2,4-дієніл	CBr	CH
CD1-C87	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CBr	CH
CD1-C88	3-нафталін-2-ілаліл	CBr	CH
CD1-C89	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CBr	CH
CD1-90	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CBr	CH
CD1-91	3-піридин-4-ілаліл	CBr	CH
CD1-92	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CBr	CH
CD1-93	4-хлорбензил	CCN	CH
CD1-94	цинаміл	CCN	CH
CD1-95	4-хлорцинаміл	CCN	CH
CD1-96	4-фторцинаміл	CCN	CH
CD1-97	4-бромцинаміл	CCN	CH
CD1-98	4-трифторметилцинаміл	CCN	CH
CD1-99	4-трифторметоксицинаміл	CCN	CH
CD1-C100	4-пентафторетоксицинаміл	CCN	CH
CD1-C101	4-метоксицинаміл	CCN	CH
CD1-C102	4-етоксицинаміл	CCN	CH
CD1-C103	4-ціаноцинаміл	CCN	CH
CD1-C104	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCN	CH
CD1-C105	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCN	CH
CD1-C106	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCN	CH
CD1-C107	3-хлор-4-фторцинаміл	CCN	CH
CD1-C108	3,5-дихлорцинаміл	CCN	CH
CD1-C109	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCN	CH
CD1-110	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCN	CH
CD1-111	3-нафталін-2-ілаліл	CCN	CH
CD1-112	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCN	CH
CD1-113	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCN	CH
CD1-114	3-піридин-4-ілаліл	CCN	CH
CD1-115	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCN	CH
CD1-116	4-хлорбензил	COMe	CH
CD1-117	цинаміл	COMe	CH
CD1-118	4-хлорцинаміл	COMe	CH
CD1-119	4-фторцинаміл	COMe	CH
CD1-120	4-бромцинаміл	COMe	CH
CD1-121	4-трифторметилцинаміл	COMe	CH
CD1-122	4-трифторметоксицинаміл	COMe	CH
CD1-123	4-пентафторетоксицинаміл	COMe	CH
CD1-124	4-метоксицинаміл	COMe	CH
CD1-125	4-етоксицинаміл	COMe	CH
CD1-126	4-ціаноцинаміл	COMe	CH
CD1-127	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COMe	CH
CD1-128	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COMe	CH
CD1-129	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COMe	CH
CD1-130	3-хлор-4-фторцинаміл	COMe	CH
CD1-131	3,5-дихлорцинаміл	COMe	CH
CD1-132	5-фенілпента-2,4-дієніл	COMe	CH
CD1-133	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COMe	CH
CD1-134	3-нафталін-2-ілаліл	COMe	CH
CD1-135	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COMe	CH
CD1-136	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COMe	CH
CD1-137	3-піридин-4-ілаліл	COMe	CH
CD1-138	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COMe	CH
CD1-139	4-хлорбензил	COCF ₃	CH
CD1-140	цинаміл	COCF ₃	CH
CD1-141	4-хлорцинаміл	COCF ₃	CH
CD1-142	4-фторцинаміл	COCF ₃	CH
CD1-143	4-бромцинаміл	COCF ₃	CH
CD1-144	4-трифторметилцинаміл	COCF ₃	CH
CD1-145	4-трифторметоксицинаміл	COCF ₃	CH

CD1-146	4-пентафторетоксицинаміл	COCF_3	CH
CD1-147	4-метоксицинаміл	COCF_3	CH
CD1-148	4-етоксицинаміл	COCF_3	CH
CD1-149	4-ціаноцинаміл	COCF_3	CH
CD1-150	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COCF_3	CH
CD1-151	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COCF_3	CH
CD1-152	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COCF_3	CH
CD1-153	3-хлор-4-фторцинаміл	COCF_3	CH
CD1-154	3,5-дихлорцинаміл	COCF_3	CH
CD1-155	5-фенілпента-2,4-дієніл	COCF_3	CH
CD1-156	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COCF_3	CH
CD1-157	3-нафталін-2-ілаліл	COCF_3	CH
CD1-158	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COCF_3	CH
CD1-159	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COCF_3	CH
CD1-160	3-піридин-4-ілаліл	COCF_3	CH
CD1-161	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COCF_3	CH
CD1-162	4-хлорбензил	CCH_3	CH
CD1-163	цинаміл	CCH_3	CH
CD1-164	4-хлорцинаміл	CCH_3	CH
CD1-165	4-фторцинаміл	CCH_3	CH
CD1-166	4-бромцинаміл	CCH_3	CH
CD1-167	4-трифторметилцинаміл	CCH_3	CH
CD1-168	4-трифторметоксицинаміл	CCH_3	CH
CD1-169	4-пентафторетоксицинаміл	CCH_3	CH
CD1-170	4-метоксицинаміл	CCH_3	CH
CD1-171	4-етоксицинаміл	CCH_3	CH
CD1-172	4-ціаноцинаміл	CCH_3	CH
CD1-173	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCH_3	CH
CD1-174	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCH_3	CH
CD1-175	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCH_3	CH
CD1-176	3-хлор-4-фторцинаміл	CCH_3	CH
CD1-177	3,5-дихлорцинаміл	CCH_3	CH
CD1-178	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCH_3	CH
CD1-179	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCH_3	CH
CD1-180	3-нафталін-2-ілаліл	CCH_3	CH
CD1-181	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCH_3	CH
CD1-182	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCH_3	CH
CD1-183	3-піридин-4-ілаліл	CCH_3	CH
CD1-184	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCH_3	CH
CD1-185	4-хлорбензил	CCF_3	CH
CD1-186	цинаміл	CCF_3	CH
CD1-187	4-хлорцинаміл	CCF_3	CH
CD1-188	4-фторцинаміл	CCF_3	CH
CD1-189	4-бромцинаміл	CCF_3	CH
CD1-190	4-трифторметилцинаміл	CCF_3	CH
CD1-191	4-трифторметоксицинаміл	CCF_3	CH
CD1-192	4-пентафторетоксицинаміл	CCF_3	CH
CD1-193	4-метоксицинаміл	CCF_3	CH
CD1-194	4-етоксицинаміл	CCF_3	CH
CD1-195	4-ціаноцинаміл	CCF_3	CH
CD1-196	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCF_3	CH
CD1-197	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCF_3	CH
CD1-198	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCF_3	CH
CD1-199	3-хлор-4-фторцинаміл	CCF_3	CH
CD1-200	3,5-дихлорцинаміл	CCF_3	CH
CD1-201	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCF_3	CH
CD1-202	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCF_3	CH
CD1-203	3-нафталін-2-ілаліл	CCF_3	CH
CD1-204	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCF_3	CH
CD1-205	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCF_3	CH
CD1-206	3-піридин-4-ілаліл	CCF_3	CH

CD1-207	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCF ₃	CH
CD1-208	4-хлорбензил	CH	CCI
CD1-209	цинаміл	CH	CCI
CD1-210	4-хлорцинаміл	CH	CCI
CD1-211	4-фторцинаміл	CH	CCI
CD1-212	4-бромцинаміл	CH	CCI
CD1-213	4-трифторметилцинаміл	CH	CCI
CD1-214	4-трифторметоксицинаміл	CH	CCI
CD1-215	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CCI
CD1-216	4-метоксицинаміл	CH	CCI
CD1-217	4-етоксицинаміл	CH	CCI
CD1-218	4-ціаноцинаміл	CH	CCI
CD1-219	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CCI
CD1-220	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CCI
CD1-221	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CCI
CD1-222	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CCI
CD1-223	3,5-дихлорцинаміл	CH	CCI
CD1-224	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CCI
CD1-225	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CCI
CD1-226	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CCI
CD1-227	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCI
CD1-228	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CCI
CD1-229	3-піридин-4-ілаліл	CH	CCI
CD1-230	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CCI
CD1-231	4-хлорбензил	CH	CF
CD1-232	цинаміл	CH	CF
CD1-233	4-хлорцинаміл	CH	CF
CD1-234	4-фторцинаміл	CH	CF
CD1-235	4-бромцинаміл	CH	CF
CD1-236	4-трифторметилцинаміл	CH	CF
CD1-237	4-трифторметоксицинаміл	CH	CF
CD1-238	4-пентафторетоксицинаміл	CH	CF
CD1-239	4-метоксицинаміл	CH	CF
CD1-240	4-етоксицинаміл	CH	CF
CD1-241	4-ціаноцинаміл	CH	CF
CD1-242	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH	CF
CD1-243	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH	CF
CD1-244	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH	CF
CD1-245	3-хлор-4-фторцинаміл	CH	CF
CD1-246	3,5-дихлорцинаміл	CH	CF
CD1-247	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH	CF
CD1-248	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH	CF
CD1-249	3-нафталін-2-ілаліл	CH	CF
CD1-250	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH	CF
CD1-251	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH	CF
CD1-252	3-піридин-4-ілаліл	CH	CF
CD1-253	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH	CF
CD1-254	4-хлорбензил	CCI	CCI
CD1-255	цинаміл	CCI	CCI
CD1-256	4-хлорцинаміл	CCI	CCI
CD1-257	4-фторцинаміл	CCI	CCI
CD1-258	4-бромцинаміл	CCI	CCI
CD1-259	4-трифторметилцинаміл	CCI	CCI
CD1-260	4-трифторметоксицинаміл	CCI	CCI
CD1-261	4-пентафторетоксицинаміл	CCI	CCI
CD1-262	4-метоксицинаміл	CCI	CCI
CD1-263	4-етоксицинаміл	CCI	CCI
CD1-264	4-ціаноцинаміл	CCI	CCI
CD1-265	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCI	CCI
CD1-266	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCI	CCI
CD1-267	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCI	CCI

CD1-268	3-хлор-4-фторцинаміл	CCI	CCI
CD1-269	3,5-дихлорцинаміл	CCI	CCI
CD1-270	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCI	CCI
CD1-271	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCI	CCI
CD1-272	3-нафталін-2-ілаліл	CCI	CCI
CD1-273	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CCI
CD1-274	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CCI
CD1-275	3-піридин-4-ілаліл	CCI	CCI
CD1-276	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCI	CCI
CD1-277	4-хлорбензил	CF	CCI
CD1-278	цинаміл	CF	CCI
CD1-279	4-хлорцинаміл	CF	CCI
CD1-280	4-фторцинаміл	CF	CCI
CD1-281	4-бромцинаміл	CF	CCI
CD1-282	4-трифторметилцинаміл	CF	CCI
CD1-283	4-трифторметоксицинаміл	CF	CCI
CD1-284	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CCI
CD1-285	4-метоксицинаміл	CF	CCI
CD1-286	4-етоксицинаміл	CF	CCI
CD1-287	4-ціаноцинаміл	CF	CCI
CD1-288	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CCI
CD1-289	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CCI
CD1-290	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CCI
CD1-291	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CCI
CD1-292	3,5-дихлорцинаміл	CF	CCI
CD1-293	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CCI
CD1-294	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CCI
CD1-295	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CCI
CD1-296	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CCI
CD1-297	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CCI
CD1-298	3-піридин-4-ілаліл	CF	CCI
CD1-299	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CCI
CD1-C300	4-хлорбензил	CCI	CF
CD1-C301	цинаміл	CCI	CF
CD1-C302	4-хлорцинаміл	CCI	CF
CD1-C303	4-фторцинаміл	CCI	CF
CD1-C304	4-бромцинаміл	CCI	CF
CD1-C305	4-трифторметилцинаміл	CCI	CF
CD1-C306	4-трифторметоксицинаміл	CCI	CF
CD1-C307	4-пентафторетоксицинаміл	CCI	CF
CD1-C308	4-метоксицинаміл	CCI	CF
CD1-C309	4-етоксицинаміл	CCI	CF
CD1-C310	4-ціаноцинаміл	CCI	CF
CD1-C311	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCI	CF
CD1-C312	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCI	CF
CD1-C313	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCI	CF
CD1-C314	3-хлор-4-фторцинаміл	CCI	CF
CD1-C315	3,5-дихлорцинаміл	CCI	CF
CD1-C316	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCI	CF
CD1-C317	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCI	CF
CD1-C318	3-нафталін-2-ілаліл	CCI	CF
CD1-C319	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CF
CD1-C320	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCI	CF
CD1-C321	3-піридин-4-ілаліл	CCI	CF
CD1-C322	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCI	CF
CD1-C323	4-хлорбензил	CF	CF
CD1-C324	цинаміл	CF	CF
CD1-C325	4-хлорцинаміл	CF	CF
CD1-C326	4-фторцинаміл	CF	CF
CD1-C327	4-бромцинаміл	CF	CF
CD1-C328	4-трифторметилцинаміл	CF	CF

CD1-C329	4-трифторметоксицинаміл	CF	CF
CD1-C330	4-пентафторетоксицинаміл	CF	CF
CD1-C331	4-метоксицинаміл	CF	CF
CD1-C332	4-етоксицинаміл	CF	CF
CD1-C333	4-ціаноцинаміл	CF	CF
CD1-C334	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF	CF
CD1-C335	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF	CF
CD1-C336	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF	CF
CD1-C337	3-хлор-4-фторцинаміл	CF	CF
CD1-C338	3,5-дихлорцинаміл	CF	CF
CD1-C339	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF	CF
CD1-C340	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF	CF
CD1-C341	3-нафталін-2-ілаліл	CF	CF
CD1-C342	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF	CF
CD1-C343	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF	CF
CD1-C344	3-піридин-4-ілаліл	CF	CF
CD1-C345	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF	CF

У таблиці CDII наведено 345 сполук формули Ib, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDIII наведено 345 сполук формули Ic, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDIV наведено 345 сполук формули Id, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDV наведено 345 сполук формули le , у якій $T1$ означає N , $T2$ означає CR^{4e} , $T3$ означає N , $T4$ означає CR^{4f} і значення $R8$, R^{4c} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDVI наведено 345 сполук формули If, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e} T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDVII наведено 345 сполук формули Ig, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDVIII наведено 345 сполук формули Ih, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f}; значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDIX наведено 345 сполук формули II, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDX наведено 345 сполук формули Ij, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXI наведено 345 сполук формули Iк, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXII наведено 345 сполук формули II, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{2e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXIII наведено 345 сполук формули Im, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3

означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXIV наведено 345 сполук формули In, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e} , T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXV наведено 345 сполук формули Іо, у якій Т1 означає N, Т2 означає CR^{4e} , Т3 означає N, Т4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXVI наведено 345 сполук формули Ir , у якій $T1$ означає N , $T2$ означає CR^{4e} , $T3$ означає N , $T4$ означає CR^{4f} і значення $R8$, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXVII наведено 345 сполук формули Iq, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXVIII наведено 345 сполук формули Ir, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e} , T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXIX наведено 345 сполук формули Is, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f}; значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXX наведено 345 сполук формули It, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXXI наведено 345 сполук формули Іu, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} і R^{4f} R наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXXII наведено 345 сполук формули Iv, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці CDXXXIII наведено 345 сполук формули Іw, у якій T1 означає N, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N, T4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

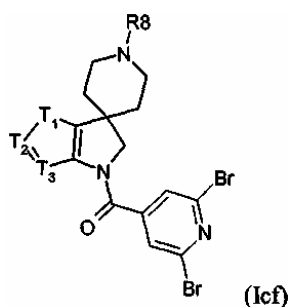
У таблиці CDXXXIV наведено 345 сполук формули Іх, у якій Т1 означає N, Т2 означає CR^{4e} , Т3 означає N, Т4 означає CR^{4f} і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DVII наведено 345 сполук формули Iq, у якій T1 означає CR^{4e}, T2 означає N, T3 озна-

У таблиці DXXIII наведено 345 сполук формули Iw, у якій T1 означає CR^{4e}, T2 означає N, T3 означає CR^{4f}, T4 означає N і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

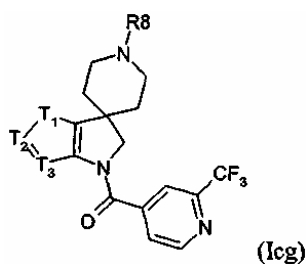
У таблиці DXL наведено 345 сполук формули Іan, у якій T1 означає CR^{4e}, T2 означає N, T3 озна-

У таблиці DLVI наведено 345 сполук формули Ibd, у якій T1 означає CR^{4e}, T2 означає N, T3 означає CR^{4f}, T4 означає N і значення R8, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.



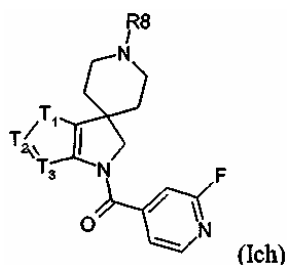
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLVII наведено 345 сполук формули Icg



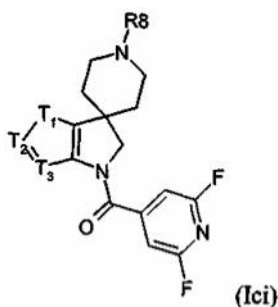
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCVIII наведено 345 сполук формули Ich



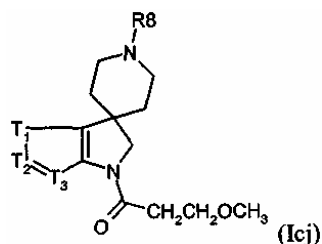
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCIX наведено 345 сполук формули Ici



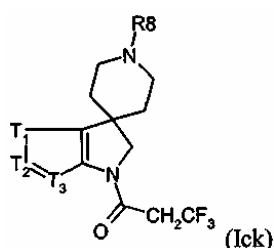
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLX наведено 345 сполук формули Icj



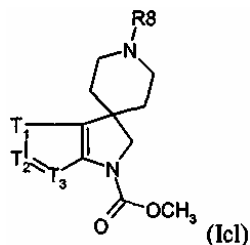
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXI наведено 345 сполук формули Ick



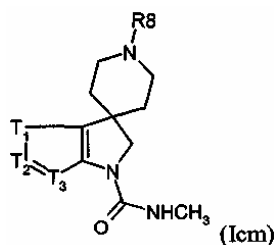
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXII наведено 345 сполук формули Icl



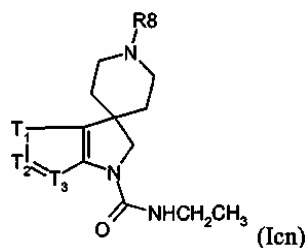
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXIII наведено 345 сполук формули Icm



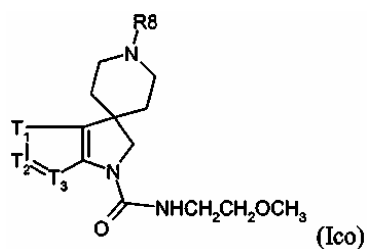
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXIV наведено 345 сполук формули Icn



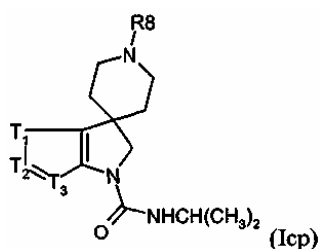
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXV наведено 345 сполук формули Ico



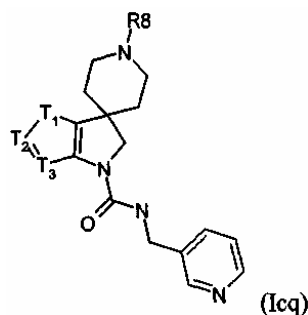
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXVI наведено 345 сполук формули Icp



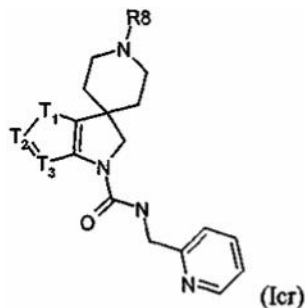
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXVII наведено 345 сполук формули Icq



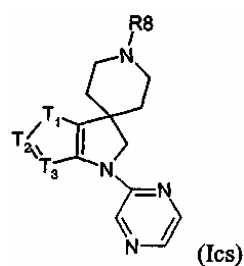
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXVIII наведено 345 сполук формули Icr



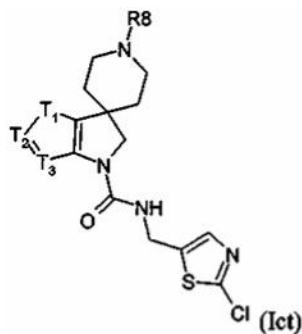
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXIX наведено 345 сполук формули Ics



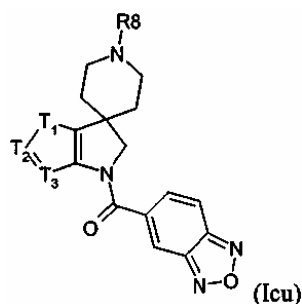
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXX наведено 345 сполук формули Ict



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

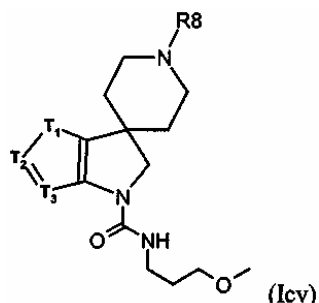
У таблиці DCXXI наведено 345 сполук формули Icu



101

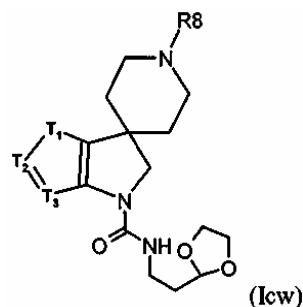
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXII наведено 345 сполук формули Icy



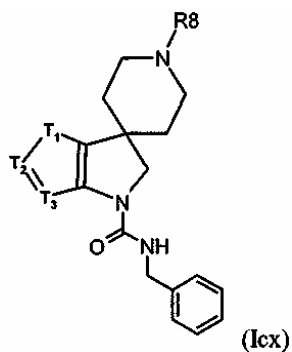
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXIII наведено 345 сполук формули Icw



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXIV наведено 345 сполук формули Icx

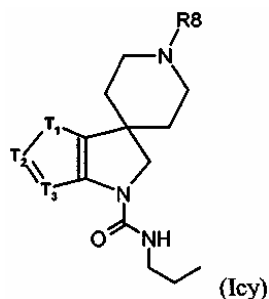


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXV наведено 345 сполук формули Icy

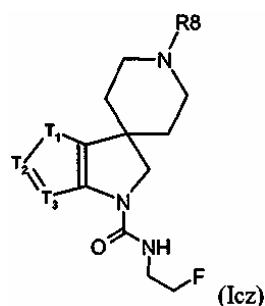
87480

102



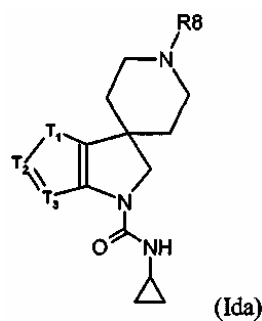
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXVI наведено 345 сполук формули Icz



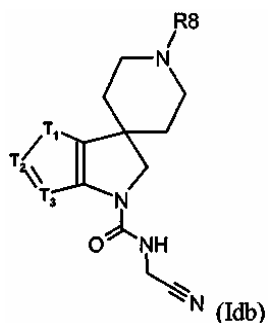
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXVII наведено 345 сполук формули Ida



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

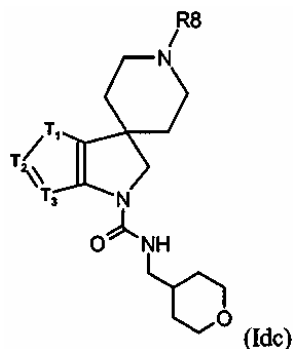
У таблиці DCXXVIII наведено 345 сполук формули Idb



103

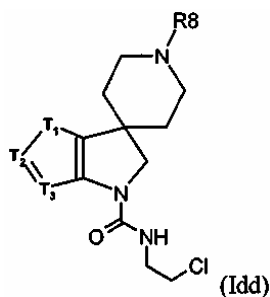
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXIX наведено 345 сполук формули Idc



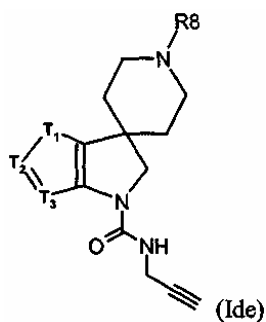
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXX наведено 345 сполук формули Idd



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXI наведено 345 сполук формули Ide

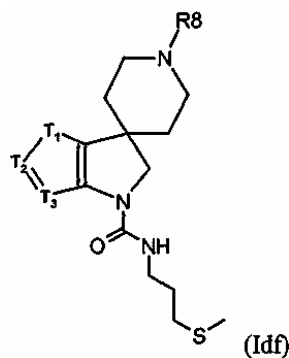


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXII наведено 345 сполук формули Idf

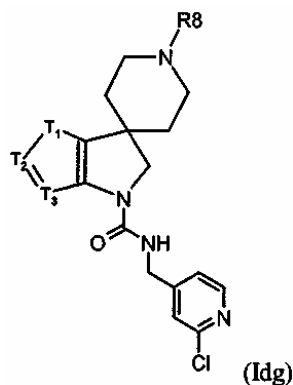
87480

104



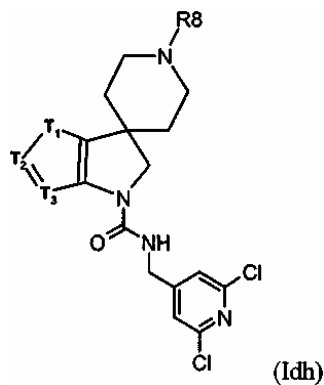
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXIII наведено 345 сполук формули Idg



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

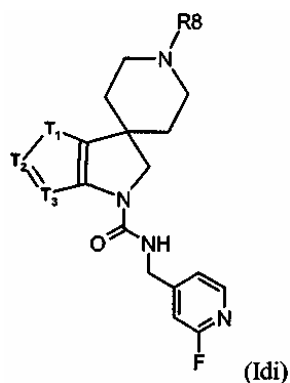
У таблиці DCXXXIV наведено 345 сполук формули Idh



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

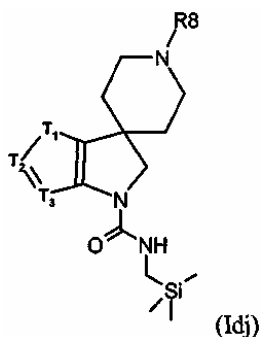
У таблиці DCXXXV наведено 345 сполук формули Idi

105



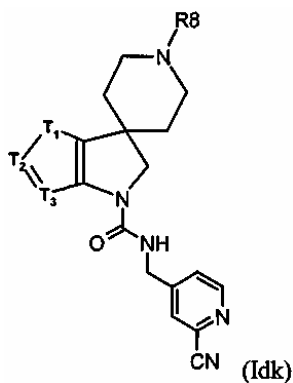
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXVI наведено 345 сполук формули Idj



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXVII наведено 345 сполук формули Idk

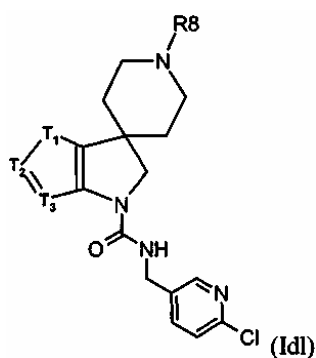


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXVIII наведено 345 сполук формули Idl

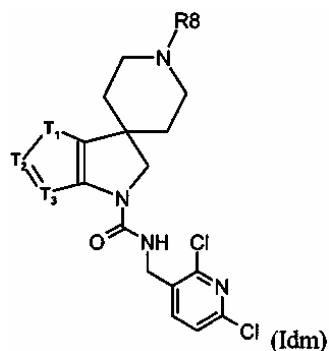
87480

106



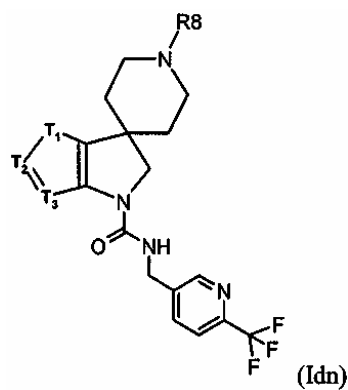
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXXXIX наведено 345 сполук формули Idm



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

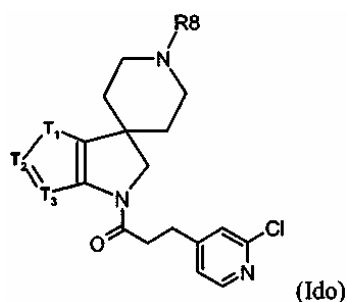
У таблиці DCXLX наведено 345 сполук формули Idn



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

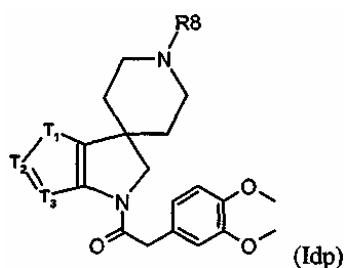
У таблиці DCXLI наведено 345 сполук формули Ido

107



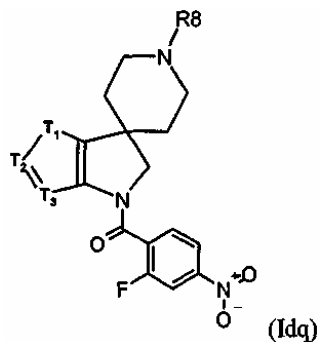
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXLII наведено 345 сполук формули Ikr



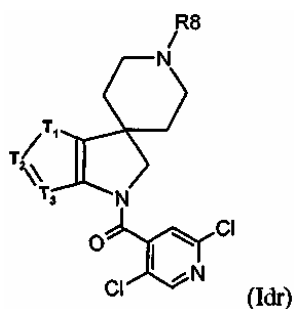
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXLIII наведено 345 сполук формули Idq



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR⁴ і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXLIV наведено 345 сполук формули Idr

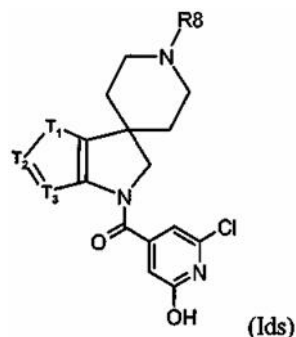


87480

108

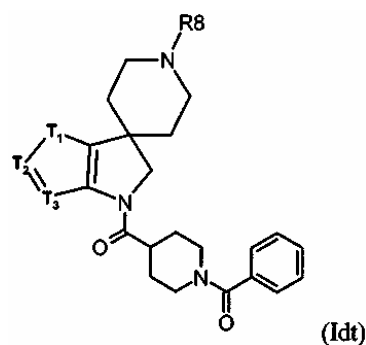
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXLV наведено 345 сполук формули Ids



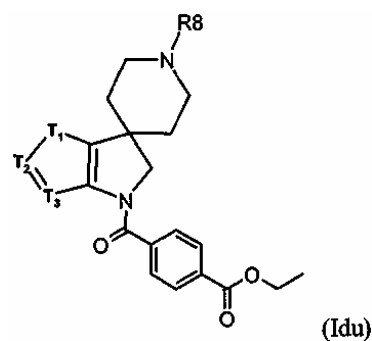
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCXLV наведено 345 сполук формули Idt



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

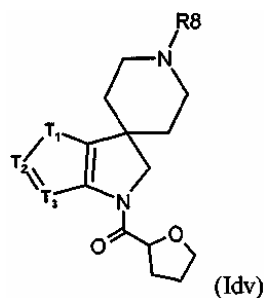
У таблиці DCXLVII наведено 345 сполук формули Idv



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

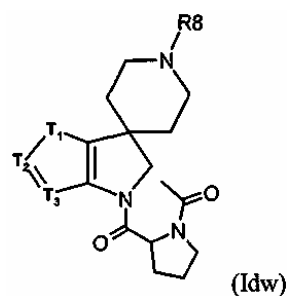
У таблиці DCXLVIII наведено 345 сполук формули Idv

109



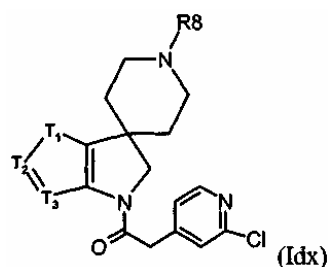
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCIL наведено 345 сполук формули Idw



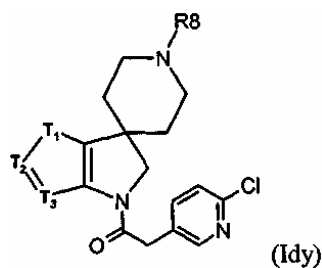
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4c} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCL наведено 345 сполук формули Idx



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLI наведено 345 сполук формули Idy

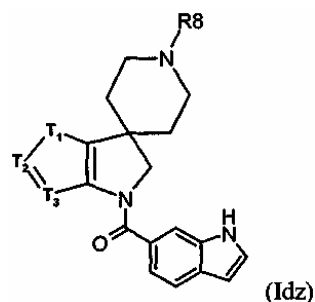


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

87480

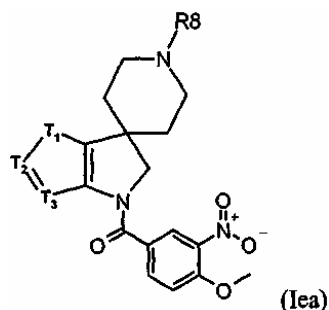
110

У таблиці DCLII наведено 345 сполук формули Idz



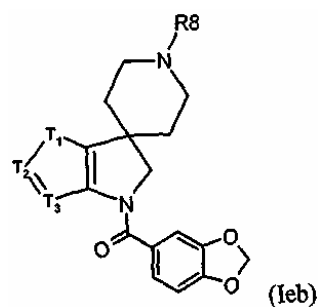
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLIII наведено 345 сполук формули Iea



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4c} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

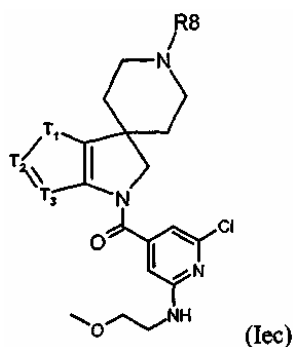
У таблиці DCLIV наведено 345 сполук формули Ieb



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

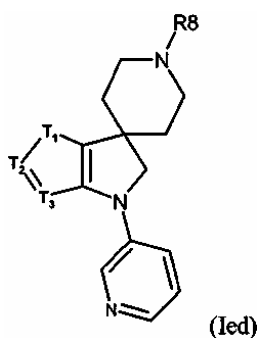
У таблиці DCLV наведено 345 сполук формули Iec

111



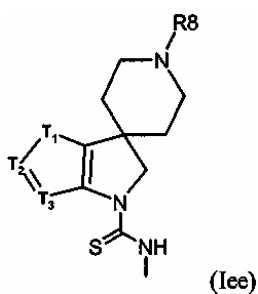
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLVI наведено 345 сполук формули Iec



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLVII наведено 345 сполук формули Iee

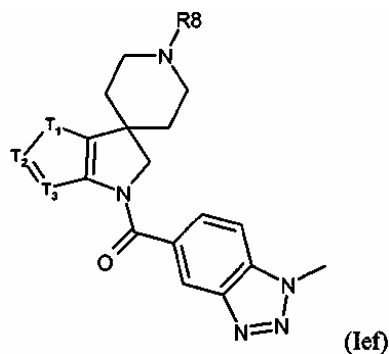


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLVIII наведено 345 сполук формули Ief

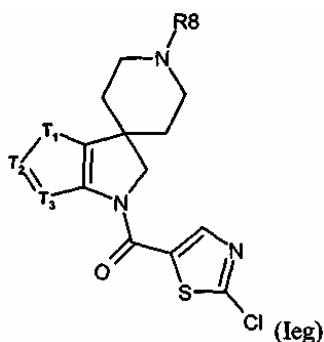
87480

112



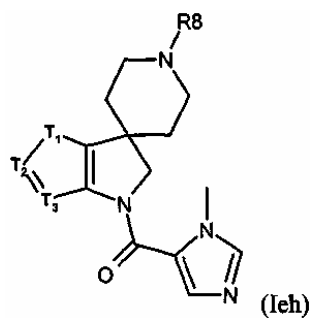
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLIX наведено 345 сполук формули Ieg



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

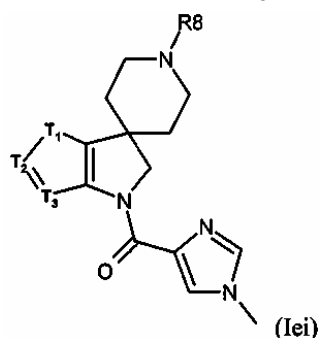
У таблиці DCLX наведено 345 сполук формули Ieh



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

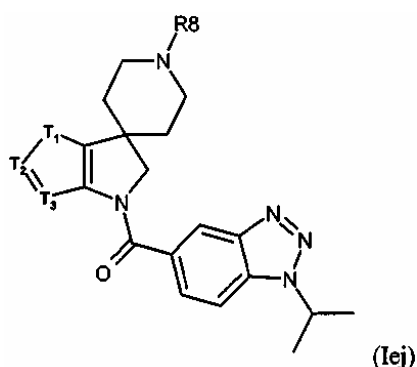
У таблиці DCLXI наведено 345 сполук формули Iei

113



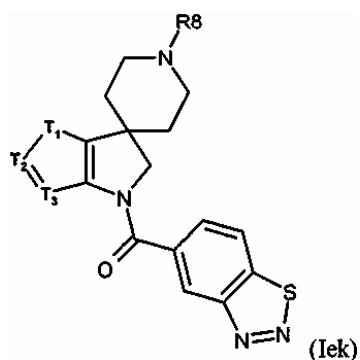
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXII наведено 345 сполук формули Iej



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXIII наведено 345 сполук формули Iek

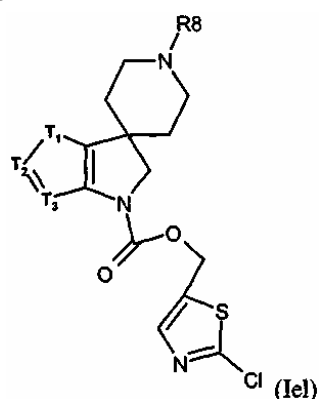


у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXIV наведено 345 сполук формули Iel

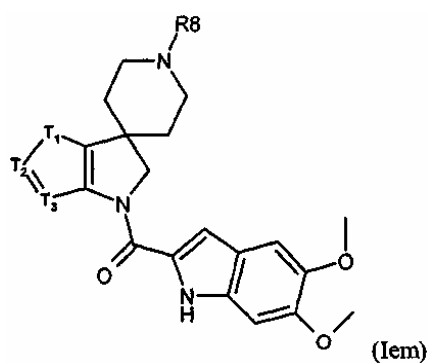
87480

114



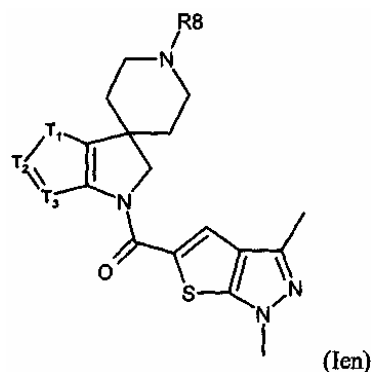
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXV наведено 345 сполук формули Iem



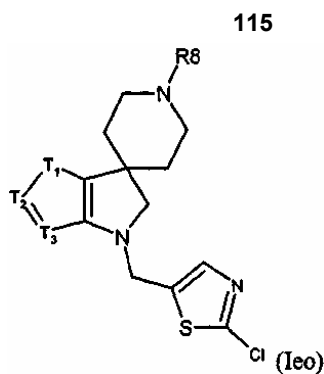
у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXVI наведено 345 сполук формули Ien



у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCLXVII наведено 345 сполук формули Ieo



87480

116

у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає CR^{4f} і значення R⁸, R^{4e} й R^{4f} наведені в таблиці 2.

У таблиці DCCI наведено 207 сполук формули Іса, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

Таблиця 3

Сполука №	R ⁸	C-R ^{4e}
DCCI-1	4-хлорбензил	CH
DCCI-2	цинаміл	CH
DCCI-3	4-хлорцинаміл	CH
DCCI-4	4-фторцинаміл	CH
DCCI-5	4-бромцинаміл	CH
DCCI-6	4-трифторметилцинаміл	CH
DCCI-7	4-трифторметоксицинаміл	CH
DCCI-8	4-пентафторетоксицинаміл	CH
DCCI-9	4-метоксицинаміл	CH
DCCI-10	4-етоксицинаміл	CH
DCCI-11	4-ціаноцинаміл	CH
DCCI-12	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CH
DCCI-13	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CH
DCCI-14	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CH
DCCI-15	3-хлор-4-фторцинаміл	CH
DCCI-16	3,5-дихлорцинаміл	CH
DCCI-17	5-фенілпента-2,4-дієніл	CH
DCCI-18	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CH
DCCI-19	3-нафталін-2-ілаліл	CH
DCCI-20	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CH
DCCI-21	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CH
DCCI-22	3-піридин-4-ілаліл	CH
DCCI-23	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CH
DCCI-24	4-хлорбензил	CF
DCCI-25	цинаміл	CF
DCCI-26	4-хлорцинаміл	CF
DCCI-27	4-фторцинаміл	CF
DCCI-28	4-бромцинаміл	CF
DCCI-29	4-трифторметилцинаміл	CF
DCCI-30	4-трифторметоксицинаміл	CF
DCCI-31	4-пентафторетоксицинаміл	CF
DCCI-32	4-метоксицинаміл	CF
DCCI-33	4-етоксицинаміл	CF
DCCI-34	4-ціаноцинаміл	CF
DCCI-35	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CF
DCCI-36	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CF
DCCI-37	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CF
DCCI-38	3-хлор-4-фторцинаміл	CF
DCCI-39	3,5-дихлорцинаміл	CF
DCCI-40	5-фенілпента-2,4-дієніл	CF
DCCI-41	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CF
DCCI-42	3-нафталін-2-ілаліл	CF
DCCI-43	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CF
DCCI-44	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CF
DCCI-45	3-піридин-4-ілаліл	CF

DCCI-46	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CF
DCCI-47	4-хлорбензил	CCl
DCCI-48	цинаміл	CCl
DCCI-49	4-хлорцинаміл	CCl
DCCI-50	4-фторцинаміл	CCl
DCCI-51	4-бромцинаміл	CCl
DCCI-52	4-трифторметилцинаміл	CCl
DCCI-53	4-трифторметоксицинаміл	CCl
DCCI-54	4-пентафторетоксицинаміл	CCl
DCCI-55	4-метоксицинаміл	CCl
DCCI-56	4-етоксицинаміл	CCl
DCCI-57	4-ціаноцинаміл	CCl
DCCI-58	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCl
DCCI-59	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCl
DCCI-60	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCl
DCCI-61	3-хлор-4-фторцинаміл	CCl
DCCI-62	3,5-дихлорцинаміл	CCl
DCCI-63	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCl
DCCI-64	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCl
DCCI-65	3-нафталін-2-ілаліл	CCl
DCCI-66	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCl
DCCI-67	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCl
DCCI-68	3-піридин-4-ілаліл	CCl
DCCI-69	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCl
DCCI-70	4-хлорбензил	CBr
DCCI-71	цинаміл	CBr
DCCI-72	4-хлорцинаміл	CBr
DCCI-73	4-фторцинаміл	CBr
DCCI-74	4-бромцинаміл	CBr
DCCI-75	4-трифторметилцинаміл	CBr
DCCI-76	4-трифторметоксицинаміл	CBr
DCCI-77	4-пентафторетоксицинаміл	CBr
DCCI-78	4-метоксицинаміл	CBr
DCCI-79	4-етоксицинаміл	CBr
DCCI-80	4-ціаноцинаміл	CBr
DCCI-81	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CBr
DCCI-82	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CBr
DCCI-83	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CBr
DCCI-84	3-хлор-4-фторцинаміл	CBr
DCCI-85	3,5-дихлорцинаміл	CBr
DCCI-86	5-фенілпента-2,4-дієніл	CBr
DCCI-87	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CBr
DCCI-88	3-нафталін-2-ілаліл	CBr
DCCI-89	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CBr
DCCI-90	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CBr
DCCI-91	3-піридин-4-ілаліл	CBr
DCCI-92	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CBr
DCCI-93	4-хлорбензил	CCN
DCCI-94	цинаміл	CCN
DCCI-95	4-хлорцинаміл	CCN
DCCI-96	4-фторцинаміл	CCN
DCCI-97	4-бромцинаміл	CCN
DCCI-98	4-трифторметилцинаміл	CCN
DCCI-99	4-трифторметоксицинаміл	CCN
DCCI-100	4-пентафторетоксицинаміл	CCN
DCCI-101	4-метоксицинаміл	CCN
DCCI-102	4-етоксицинаміл	CCN
DCCI-103	4-ціаноцинаміл	CCN
DCCI-104	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCN
DCCI-105	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCN
DCCI-106	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCN

DCCI-107	3-хлор-4-фторцинаміл	CCN
DCCI-108	3,5-дихлорцинаміл	CCN
DCCI-109	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCN
DCCI-110	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCN
DCCI-111	3-нафталін-2-ілаліл	CCN
DCCI-112	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCN
DCCI-113	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCN
DCCI-114	3-піридин-4-ілаліл	CCN
DCCI-115	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCN
DCCI-116	4-хлорбензил	COMe
DCCI-117	цинаміл	COMe
DCCI-118	4-хлорцинаміл	COMe
DCCI-119	4-фторцинаміл	COMe
DCCI-120	4-бромцинаміл	COMe
DCCI-121	4-трифторметилцинаміл	COMe
DCCI-122	4-трифторметоксицинаміл	COMe
DCCI-123	4-пентафторетоксицинаміл	COMe
DCCI-124	4-метоксицинаміл	COMe
DCCI-125	4-етоксицинаміл	COMe
DCCI-126	4-ціаноцинаміл	COMe
DCCI-127	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COMe
DCCI-128	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COMe
DCCI-129	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COMe
DCCI-130	3-хлор-4-фторцинаміл	COMe
DCCI-131	3,5-дихлорцинаміл	COMe
DCCI-132	5-фенілпента-2,4-дієніл	COMe
DCCI-133	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COMe
DCCI-134	3-нафталін-2-ілаліл	COMe
DCCI-135	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COMe
DCCI-136	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COMe
DCCI-137	3-піридин-4-ілаліл	COMe
DCCI-138	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COMe
DCCI-139	4-хлорбензил	COCF ₃
DCCI-140	цинаміл	COCF ₃
DCCI-141	4-хлорцинаміл	COCF ₃
DCCI-142	4-фторцинаміл	COCF ₃
DCCI-143	4-бромцинаміл	COCF ₃
DCCI-144	4-трифторметилцинаміл	COCF ₃
DCCI-145	4-трифторметоксицинаміл	COCF ₃
DCCI-146	4-пентафторетоксицинаміл	COCF ₃
DCCI-147	4-метоксицинаміл	COCF ₃
DCCI-148	4-етоксицинаміл	COCF ₃
DCCI-149	4-ціаноцинаміл	COCF ₃
DCCI-150	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	COCF ₃
DCCI-151	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	COCF ₃
DCCI-152	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	COCF ₃
DCCI-153	3-хлор-4-фторцинаміл	COCF ₃
DCCI-154	3,5-дихлорцинаміл	COCF ₃
DCCI-155	5-фенілпента-2,4-дієніл	COCF ₃
DCCI-156	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	COCF ₃
DCCI-157	3-нафталін-2-ілаліл	COCF ₃
DCCI-158	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	COCF ₃
DCCI-159	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	COCF ₃
DCCI-160	3-піридин-4-ілаліл	COCF ₃
DCCI-161	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	COCF ₃
DCCI-162	4-хлорбензил	CCH ₃
DCCI-163	цинаміл	CCH ₃
DCCI-164	4-хлорцинаміл	CCH ₃
DCCI-165	4-фторцинаміл	CCH ₃
DCCI-166	4-бромцинаміл	CCH ₃
DCCI-167	4-трифторметилцинаміл	CCH ₃

DCCI-168	4-трифторметоксицинаміл	CCH ₃
DCCI-169	4-пентафторетоксицинаміл	CCH ₃
DCCI-170	4-метоксицинаміл	CCH ₃
DCCI-171	4-етоксицинаміл	CCH ₃
DCCI-172	4-ціаноцинаміл	CCH ₃
DCCI-173	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCH ₃
DCCI-174	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCH ₃
DCCI-175	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCH ₃
DCCI-176	3-хлор-4-фторцинаміл	CCH ₃
DCCI-177	3,5-дихлорцинаміл	CCH ₃
DCCI-178	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCH ₃
DCCI-179	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCH ₃
DCCI-180	3-нафталін-2-ілаліл	CCH ₃
DCCI-181	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCH ₃
DCCI-182	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCH ₃
DCCI-183	3-піридин-4-ілаліл	CCH ₃
DCCI-184	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCH ₃
DCCI-185	4-хлорбензил	CCF ₃
DCCI-186	цинаміл	CCF ₃
DCCI-187	4-хлорцинаміл	CCF ₃
DCCI-188	4-фторцинаміл	CCF ₃
DCCI-189	4-бромцинаміл	CCF ₃
DCCI-190	4-трифторметилцинаміл	CCF ₃
DCCI-191	4-трифторметоксицинаміл	CCF ₃
DCCI-192	4-пентафторетоксицинаміл	CCF ₃
DCCI-193	4-метоксицинаміл	CCF ₃
DCCI-194	4-етоксицинаміл	CCF ₃
DCCI-195	4-ціаноцинаміл	CCF ₃
DCCI-196	3-(6-хлорпіридин-3-іл)-аліл	CCF ₃
DCCI-197	3-(4-хлорфеніл)-бут-2-еніл	CCF ₃
DCCI-198	3-(4-хлорфеніл)-3-фтораліл	CCF ₃
DCCI-199	3-хлор-4-фторцинаміл	CCF ₃
DCCI-200	3,5-дихлорцинаміл	CCF ₃
DCCI-201	5-фенілпента-2,4-дієніл	CCF ₃
DCCI-202	4-ізопропілоксикарбоніламіноцинаміл	CCF ₃
DCCI-203	3-нафталін-2-ілаліл	CCF ₃
DCCI-204	3-(5-трифторметилпіридин-2-іл)-аліл	CCF ₃
DCCI-205	3-(5-хлорпіридин-2-іл)-аліл	CCF ₃
DCCI-206	3-піридин-4-ілаліл	CCF ₃
DCCI-207	3-(2-хлорпіридин-4-іл)-аліл	CCF ₃

У таблиці DCCII наведено 207 сполук формули Icb, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCIII наведено 207 сполук формули Icc, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCIV наведено 207 сполук формули Icd, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCV наведено 207 сполук формули Ice, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCVI наведено 207 сполук формули Icf, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCVII наведено 207 сполук формули Icg, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCVIII наведено 207 сполук формули Ich, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCIX наведено 207 сполук формули Ici, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCX наведено 207 сполук формули Icj, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCXI наведено 207 сполук формули Ick, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCXII наведено 207 сполук формули Icl, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCXIII наведено 207 сполук формули Icm, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCXIV наведено 207 сполук формули Icn, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCXV наведено 207 сполук формули Ico, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLVII наведено 207 сполук формули Iee, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLVIII наведено 207 сполук формули Ief, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLIX наведено 207 сполук формули Ieg, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLX наведено 207 сполук формули Ieh, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXI наведено 207 сполук формули Iei, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXII наведено 207 сполук формули Iej, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXIII наведено 207 сполук формули Iek, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXIV наведено 207 сполук формули Iel, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXV наведено 207 сполук формули Iem, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXVI наведено 207 сполук формули Ien, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

У таблиці DCCLXVII наведено 207 сполук формули Ieo, у якій T1 означає S, T2 означає CR^{4e}, T3 означає N і значення R⁸ й R^{4e} наведені в таблиці 3.

Мас-спектри деяких сполук, наведених у таблицях I-DCCLXVII, отримані за допомогою РХМС (рідинна хроматографія-мас-спектроскопія): LC5 (або РХМС:LC3; часи утримання, позначені значком * у таблиці 4): 254nm - градієнтний режим від 10% А до 100% В А H₂O+0,01%НCOOH; В=CH₃CN/CH₃OH+0,01 %HCOOH електророзпилення позитивним зарядом 150-1000 m/z.

Ці дані наведені в таблиці 4.

Таблиця 4

Сполука	РХМС (час утримання, хв)	РХМС (M+H)	Температура плавлення
I-26	1'44*	400	
I-29	1'49*	434	
I-30	1'52*	450	
I-210	1'54*	416	
I-213	1'55*	450	
I-214	1'59*	466	
I-233	1'45*	400	
I-236	1'52*	434	
I-237	1'49*	450	
II-26	1'49*	463	
II-29	1'54*	497	
II-30	1'58*	513	
II-210	1'98	479	
II-213	2'13	513	
II-214	2'13	529	
III-3	2'46	479	
III-6	2'13	513	
III-7	2'31	529	
III-26	2'42	497	
III-29	2'64	531	

III-30	2'63	547	
III-210	2'26	513	
III-210	2'36	529	
N-оксид	2'40	547	
III-213	2'40	563	
III-214	2'12	497	
III-233	2'20	531	
III-236	2'27	547	
III-302	2'40	493	
III-325	2'63	547	
III-328	2'47	581	
III-329	2'46	597	
V-26	2'65	531	
V-29	2'75	565	
V-30	2'60	581	
V-209	2'33	513	
V-210	2'83	547	
V-213	2'62	581	
V-214	2'41	597	
V-233	2'19	531	
V-236	2'28	565	
V-237	2'84	581	
V-509	1'82*	565	
VIII-26	1'55*	481	
VIII-29	1'59*	515	
VIII-30	1'63*	531	
VIII-210	1'57*	497	
VIII-213	1'77*	531	
VIII-214	1'61*	547	
XX-26	1'64*	532	
XX-29	1'67*	566	
XX-30	1'69*	582	
XX-210	2'72	548	
XX-213	1'74*	582	
XX-214	1'75*	598	
XX-233	2'54	532	
XX-236	1'65*	566	
XX-237	1'69*	582	
CIII-49			208
CIII-52			91-93
CIII-53			78-80
CIII-210			95-96
CIII-214			81-C83
CIII-555			107
CCIII-3	1'91	479	
CCIII-6	2'02	513	
CCIII-7	1'74	529	
CCCI-3	1'77	382	
CCCIII-3	1'98	479	
CCCIII-26	2'04	497	
CCCIII-29	2'15	531	
CCCIII-30	2'19	547	
CCCV-3	2'24	513	
CCCV-26	2'32	531	
CCCV-29	2'42	565	
CCCV-30	2'45	581	
CCCVI-3	2'30	603	
CDIII-49	1'56*	514	
CDIII-52	1'60*	548	
CDIII-53	1'62*	564	

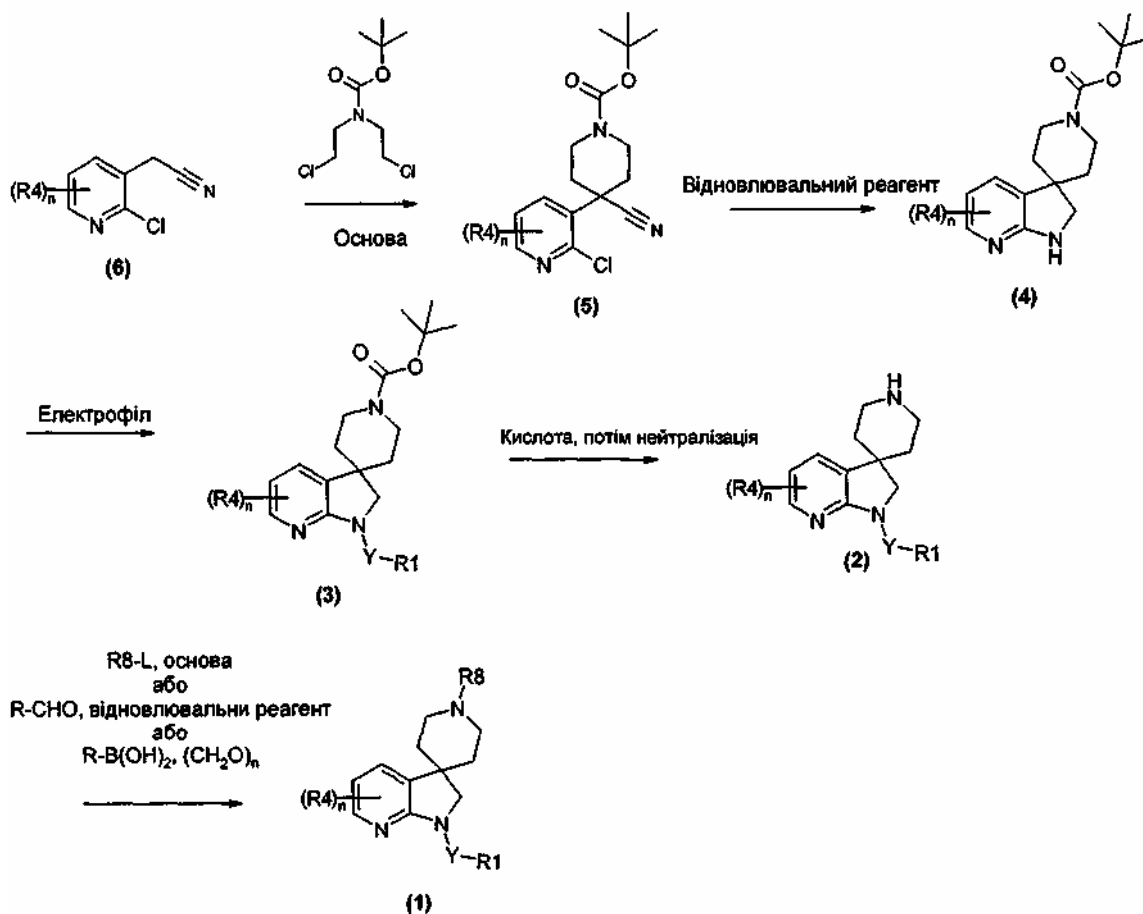
127			
CDV-49	1'66*	548	
CDV-52	1'72*	582	
DIII-3	2'32	480	
DIII-210	2'41	514	
DV-3	2'17	514	
DV-210	2'47	582	
DV-213	2'37	548	
DV-214	2'51	598	
DCIII-3			81-C82

87480

128			
DCIII-6			73-C77
DCIII-7			70-74
DCIII-49			69-72
DCIII-52			75
DCIII-53			70
DCV-53			62

Сполуки, запропоновані в даному винаході, можна одержати різними шляхами. Наприклад, так, як це показано на схемі I.

СХЕМА I



Так, сполуку формули 1 можна синтезувати зі сполуки формули 2 за реакцією з алкілювальним реагентом формули R8-L, у якій L означає хлорид, бромід, йодид або сульфонат (наприклад, мезилат або тозилат) або аналогічну групу, яку відщеплюють, при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C, звичайно - 65°C, в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності третинної аміно-основи, такої як триетиламін або діізопропіламін, і необов'язково при каталізі галогенідами, такими як йодид натрію, йодид калію або тетрабутиламоніййодид.

Альтернативно, сполуку формули 2 можна ввести в реакцію з альдегідом формули RCHO при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або етанол або суміші розчинників, у присутності відновного реагенту,

такого як комплекс боран-піридин, борогідрид натрію, (триацетокси)борогідрид натрію, ціаноборогідрид натрію й т.п., і одержати сполуку формули 1, у якій R8 означає CH₂-R.

Альтернативно, сполуку формули 2 можна ввести в реакцію з параформальдегідом і бороноювою кислотою формули R-B(OH)₂ при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C в органічному розчиннику, такому як етанол, 1,4-діоксан, або у воді й одержати сполуку формули 1, у якій R8 означає CH₂-R.

Сполуку формули 2 можна одержати зі сполуки формули 3 за реакцією з кислотою, такою як трифтороцтова кислота, при температурі навколишнього середовища в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан з наступною нейтралізацією реакційної суміші водним розчином неорганічної основи,

такої як карбонат натрію, бікарбонат натрію або аналогічна сполука.

Сполуки формули 3 можна одержати зі сполук формули 4 за реакцією з підходящими електрофільними реагентами. Сполуки формули 3, у якій Y означає карбонільну групу, можна одержати за реакцією сполуки формули 4 з похідним карбонової кислоти формули $R^1-C(O)-Z$, у якій Z означає хлор, гідроксигрупу, алкоксигрупу або ацилоксигрупу, при температурі від 0°C до 150°C необов'язково в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, необов'язково в присутності третинної амінооснови, такої як триетиламін або діізопропіламін і необов'язково в присутності реагенту реакції сполучення, такого як дициклогексилкарбодіімід. Сполуки формули 3, у якій Y означає карбонільну групу й R1 означає амінний замісник формули R^1-NH- , можна одержати за реакцією сполуки формули 3 з ізоціанатом формули $R^1-N=C=O$ при подібних умовах. Сполуки формули 3, у якій Y означає групу формули $S(O)_q$, можна одержати зі сполуки формули 4 шляхом обробки сполукою формули $R^1-S(O)_q-Cl$ при подібних умовах. Сполуки формули 3, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R1 означає амінний замісник формули R^1-NH- , можна одержати за реакцією сполуки формули 3 з ізоціанатом формули $R^1-N=C=S$ при подібних умовах. Альтернативно сполуки формули 3, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R1 означає вуглецевмісний замісник, можна одержати шляхом обробки сполуки формули 3, у якій Y означає карбонільну групу й

R1 означає вуглецевмісний замісник, що підходить тіонілюючим реагентом, таким як реагент Лавесона.

У наведених вище методиках похідні кислот формули $R^1-C(O)-Z$, ізоціанати формули $R^1-N=C=O$, ізоціанати формули $R^1-N=C=S$ і сірковмісні електрофіли формули $R^1-S(O)_q-Cl$ є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Сполуки формули 4 можна одержати зі сполук формули 5 за реакцією з підходящим відновним реагентом, таким як три-трет-бутоксіалюмогідрид літію або аналогічні гідриди або алкоксигідриди, в органічному розчиннику, такому як діоксан при температурі від 100°C до 125°C за методикою, описаною в WO-0027845.

Сполуки формули 5 можна одержати зі сполук формули 6 за методикою, описаною в WO00/27845.

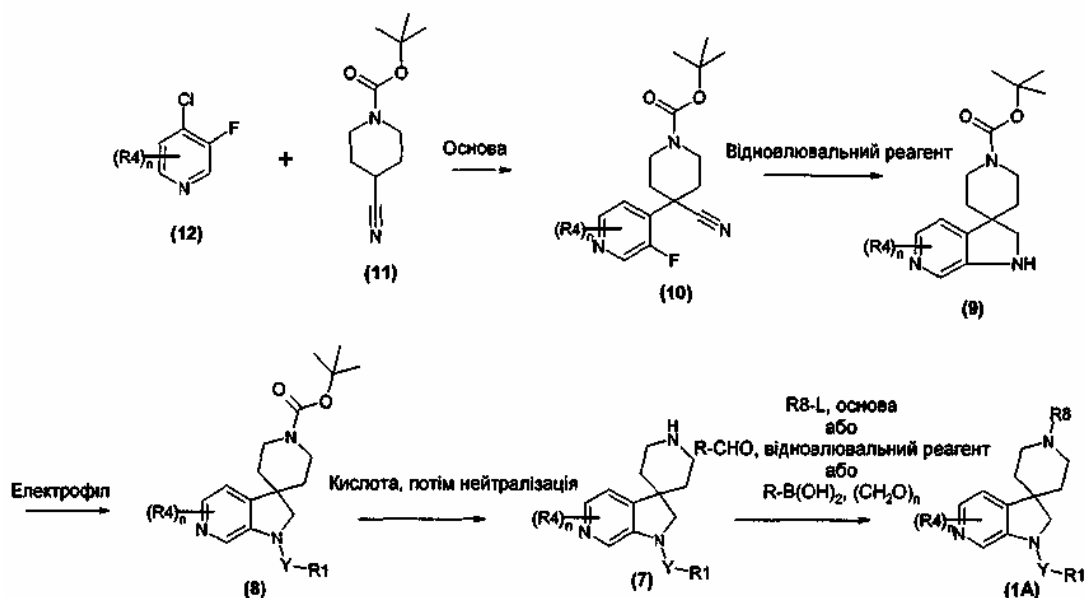
Сполуки формули 6 можна одержати за методикою, описаною в публікації Bremner та ін. в Synthesis 1991, 528.

Сполуки формули 5 й 6 є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Деякі сполуки формули 2, 3 й 4 є новими сполуками і як такі утворюють ще один об'єкт даного винаходу.

Альтернативно сполуки формули 1 можна одержати за реакціями, представленими на схемі II

СХЕМА II



Так, сполуку формули 1A можна синтезувати зі сполуки формули 7 за реакцією з алкілювальним реагентом формули R8-L, у якій L означає хлорид, бромід, йодид або сульфат (наприклад, мезилат або тозилат) або аналогічну групу, яку відщеплюють, при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C , звичайно - 65°C , в органічному розчиннику, такому як дихлорметан,

хлороформ або 1,2-дихлоретан у присутності третинної амінооснови, такої як триетиламін або діізопропіламін і необов'язково при каталізі галогенідами, такими як йодид натрію, йодид калію або тетрабутиламоніййодид.

Альтернативно, сполуку формули 7 можна ввести в реакцію з альдегідом формули RCHO при температурі від температури навколишнього се-

редовища до 100°C в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або етанол або суміші розчинників, у присутності відновного реагенту, такого як комплекс боран-піридин, борогідрид натрію, (триацетокси)борогідрид натрію, ціаноборогідрид натрію й т.п., і одержати сполуку формули 1A, у якій R8 означає $\text{CH}_2\text{-R}$.

Альтернативно, сполуку формули 7 можна ввести в реакцію з параформальдегідом і бороновою кислотою формули R-B(OH)_2 при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C в органічному розчиннику, такому як етанол, 1,4-діоксан, або у воді й одержати сполуку формули 1A, у якій R8 означає $\text{CH}_2\text{-R}$.

Сполуку формули 7 можна одержати зі сполуки формули 8 за реакцією з кислотою, такою як трифтороцтова кислота, при температурі навколишнього середовища в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан з наступною нейтралізацією реакційної суміші водним розчином неорганічної основи, такої як карбонат натрію, бікарбонат натрію або аналогічна сполука.

Сполуки формули 8 можна одержати зі сполук формули 9 за реакцією з підходящими електрофільними реагентами. Сполуки формули 8, у якій Y означає карбонільну групу, можна одержати за реакцією сполуки формули 9 з похідним карбонової кислоти формули R1-C(O)-Z , у якій Z означає хлор, гідроксигрупу, алкоксигрупу або ацилоксигрупу, при температурі від 0°C до 150°C, необов'язково в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, необов'язково в присутності третинної амінооснови, такої як триетиламін або діізопропіламін і необов'язково у присутності реагенту реакції сполучення, такого як дициклогексилкарбодіімід. Сполуки формули 8, у якій Y означає карбонільну групу й R1 означає амінний замісник формули R'-NH- , можна одержати за реакцією сполуки формули 9 з ізоціанатом формули R'-N=C=O при подібних умо-

вах. Сполуки формули 8, у якій Y означає групу формули S(O)_q , можна одержати зі сполуки формули 9 шляхом обробки сполукою формули $\text{R1-S(O)}_q\text{-Cl}$ при подібних умовах. Сполуки формули 8, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R1 означає амінний замісник формули R'-NH- , можна одержати за реакцією сполуки формули 8 з ізотіоціанатом формули R'-N=C=S при подібних умовах. Альтернативно сполуки формули 8, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R1 означає вуглецевмісний замісник, можна одержати шляхом обробки сполуки формули 8, у якій Y означає карбонільну групу й R1 означає вуглецевмісний замісник, підходящим тіонілюючим реагентом, таким як реагент Лавесона.

У наведених вище методиках похідні кислот формули R1-C(O)-Z , ізоціанати формули R'-N=C=O , ізотіоціанати формули R'-N=C=S і сірковмісні електрофіли формули $\text{R1-S(O)}_q\text{-Cl}$ є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Сполуки формули 9 можна одержати зі сполук формули 10 за реакцією з підходящим відновним реагентом, таким як три-трет-бутоксіалюмогідрид літію або аналогічні гідриди або алкоксигідриди, в органічному розчиннику, такому як діоксан при температурі від 100°C до 125°C за методикою, описаною в WO00/27845.

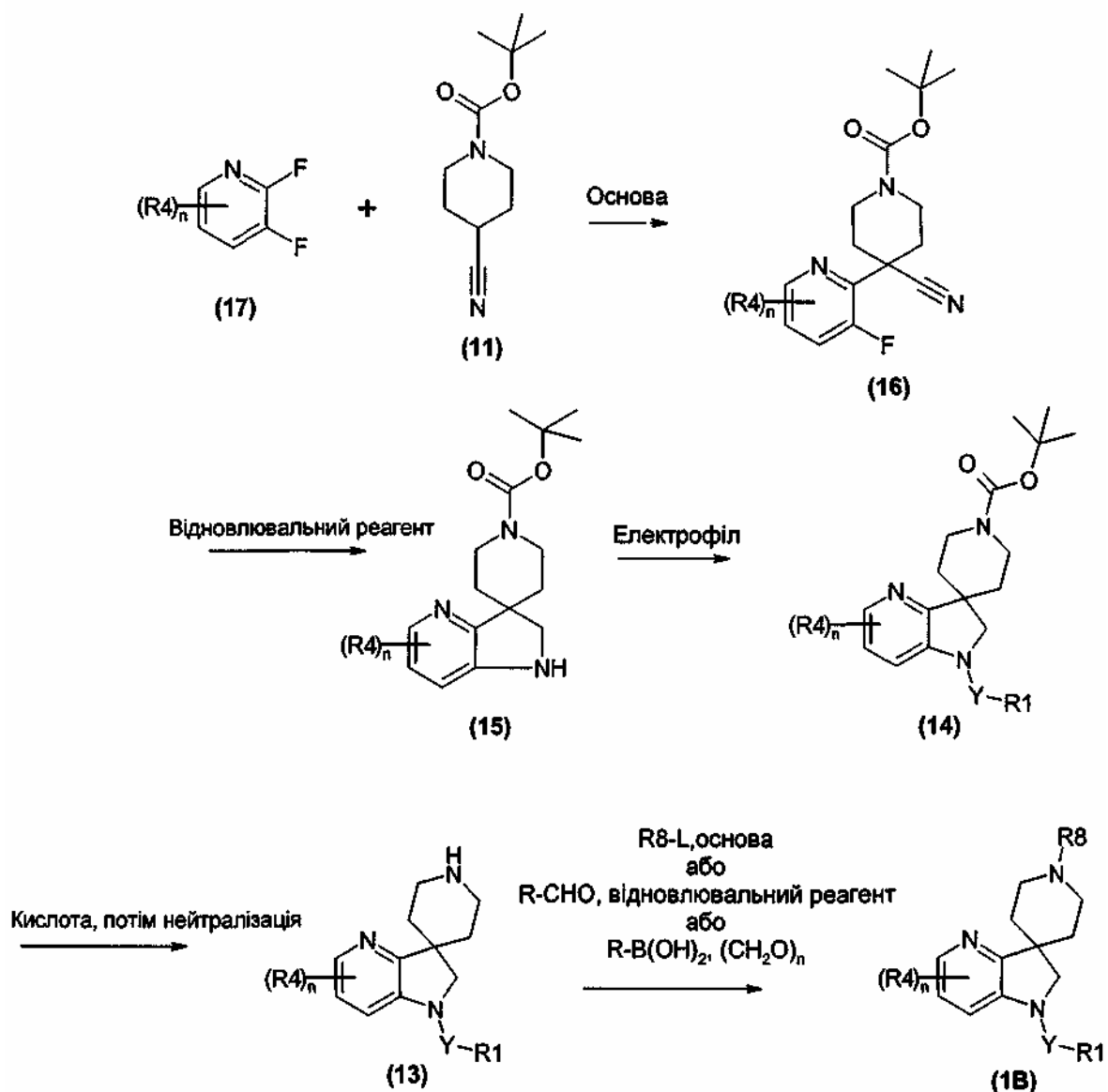
Сполуки формули 10 можна одержати зі сполук формули 11 й 12 за відомими методиками.

Сполуки формули 10, 11 й 12 є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Деякі сполуки формули 7, 8 й 9 є новими сполуками і як такі утворюють ще один об'єкт даного винаходу.

Сполуки формули 1 також можна одержати способами, описаними на схемі III:

СХЕМА III

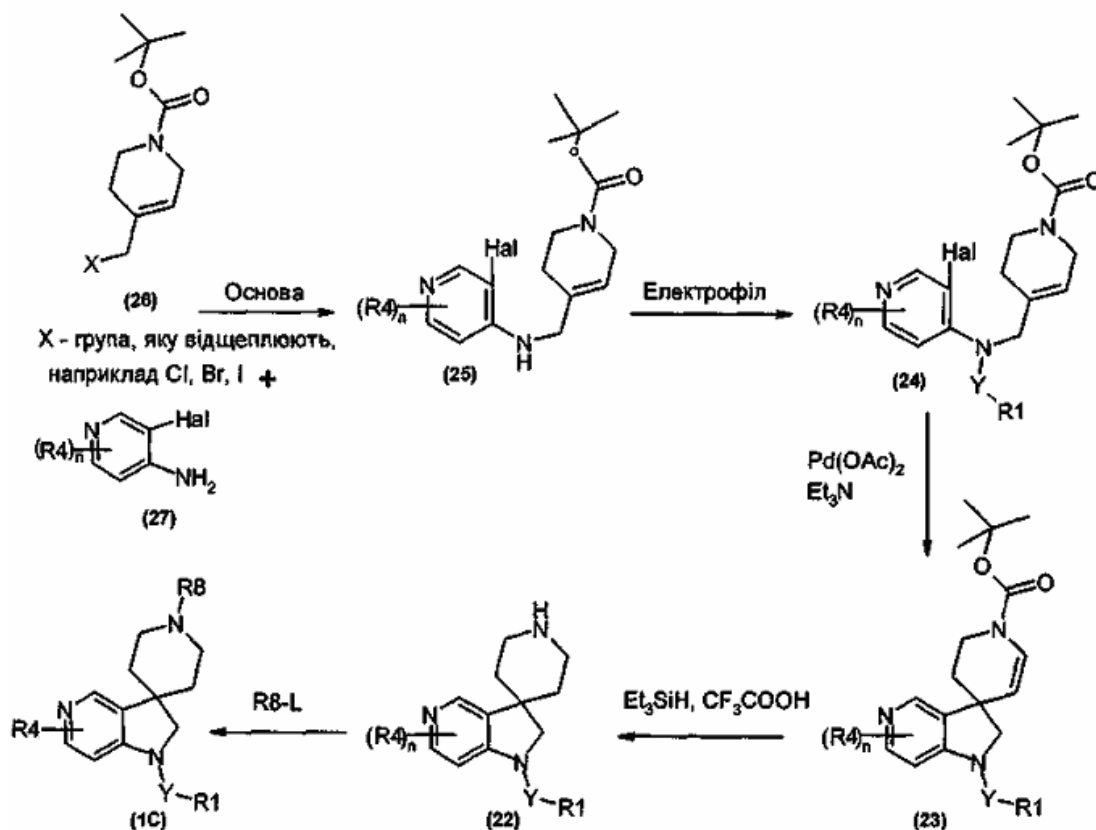


Сполуки формули 16 й 17 є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Деякі сполуки формули 13, 14 й 15 є новими сполуками і як такі утворюють ще один об'єкт даного винаходу.

Крім того, сполуки формули I можна одержати способом, описаним на схемі IV.

CXEMA IV



Сполуку формули 1C можна синтезувати зі сполуки формули 22 за реакцією з алкілувальним реагентом формули R8-L, у якій L означає хлорид, бромід, йодид або сульфат (наприклад, мезилит або тозилат) або аналогічну групу, яку відщеплюють, при температурі від температури навколишнього середовища до 100°C, звичайно - при температурі навколишнього середовища, в органічному розчиннику, такому як ацетонітрил, диметилформамід, дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, у присутності третинного амінооснови, такої як триетиламін або діізопропіламін, і необов'язково при каталізі галогенідами, такими як йодид натрію, йодид калію або тетрабутиламоній-йодид.

Сполуку формули 22 можна одержати зі сполуки формули 23 за реакцією з кислотою, такою як трифтороцтова кислота, і відновним реагентом, таким як триетилсилан, при температурі навколишнього середовища в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, з наступною нейтралізацією реакційної суміші водним розчином неорганічної основи, такої як карбонат натрію, бікарбонат натрію або аналогічна сполука.

Сполуку формули 23 можна одержати шляхом циклізації сполуки формули 24 при умовах реакції Хека в присутності каталізатора, такого як ацетат паладію, необов'язково ліганду, такого як трифенілфосфін й/або добавки, такої як тетрабутиламонійбромід, і основи, такої як триетиламін, в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран,

ацетонітрил або диметилформамід при температурі від 50 до 140°C.

Сполуки формули 24 можна одержати зі сполук формули 25 за реакцією з підходящими електрофільними реагентами. Сполуки формули 24, у якій Y означає карбонільну групу, можна одержати за реакцією сполуки формули 25 з похідним карбонової кислоти формули R¹-C(O)-Z, де Z означає хлор, гідроксигрупу, алкоксигрупу або ацилоксигрупу, при температурі від 0 до 150°C, необов'язково в органічному розчиннику, такому як дихлорметан, хлороформ або 1,2-дихлоретан, необов'язково в присутності третинного амінооснови, такої як триетиламін або діізопропіламін, і необов'язково в присутності реагенту реакції сполучення, такого як дициклогексилкарбодіімід. Сполуки формули 24, у якій Y означає карбонільну групу й R¹ означає амінний замісник формули R¹-NH-, можна одержати за реакцією сполуки формули 25 з ізоціанатом формули R¹-N=C=O при подібних умовах. Сполуки формули 1C, у якій Y означає групу формули S(O)_q, можна одержати зі сполуки формули 22 шляхом обробки сполукою формули R¹-S(O)_q-Cl при подібних умовах. Сполуки формули 24, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R¹ означає амінний замісник формули R¹-NH-, можна одержати за реакцією сполуки формули 25 з ізотіоціанатом формули R¹-N=C=S при подібних умовах. Альтернативно сполуки формули 24, у якій Y означає тіокарбонільну групу й R¹ означає вуглецевмісний замісник, можна одержати шляхом обробки сполуки формули 24, у якій Y означає кар-

бонільну групу, і R1 означає вуглецевмісний замісник, що підходить тіонілюючим реагентом, таким як реагент Лавесона.

У наведених вище методиках похідні кислот формули R1-C(O)-Z, ізоціанати формули R'-N=C=O, ізотіоціанати формули R'-N=C=S і сірко-вмісні електрофіли формули R1-S(O)_q-Cl є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Сполуки формули 25 можна синтезувати шляхом алкілювання сполуки формули 27 (у якій при необхідності аміногрупу можна захистити, наприклад, ацильною групою, яку можна видалити після проведення реакції) зі сполукою формули 26 у присутності основи, такої як гідрид натрію, алюмогідрид літію або трет-бутоксид калію, при температурі від -78 до 100°C в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або диметилформамід. Сполуки формули 25, 26 й 27 є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за

методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Деякі сполуки формули 22, 23 й 24 є новими сполуками і як такі утворюють ще один об'єкт даного винаходу.

Сполуки формули I, у якій R² й R³ не означають водень, можна одержати за методиками, описаними в WO03/106457. Так, наприклад, сполуку формули 26а або 36а, які є сполуками формули 26 й 36 відповідно, у яких до атома вуглецю, який сусідній з групою X, яку відщеплюють, приєднані групи R² й R³, можна перетворити в сполуки формули I за методиками, описаними для перетворення сполук 26 й 36 відповідно в сполуки формули I.

Сполуки, у яких кільце T є гетероароматичним кільцем (таким як піримідин або тіофен), можна одержати за методиками синтезу, описаними, наприклад, у публікації Organic Reactions (New York) (2002), 60, 157, за методиками, представленими на схемі V або схемі VI (обидві засновані на внутрішньомолекулярних реакціях Хека):

СХЕМА V

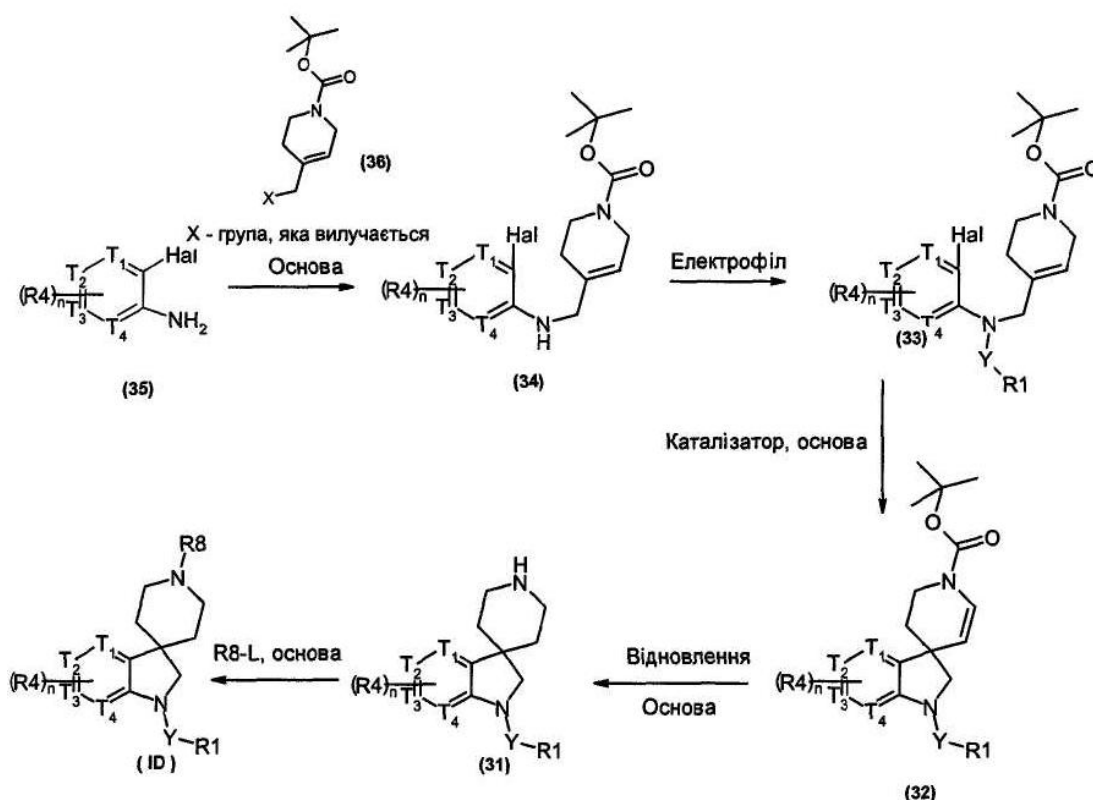
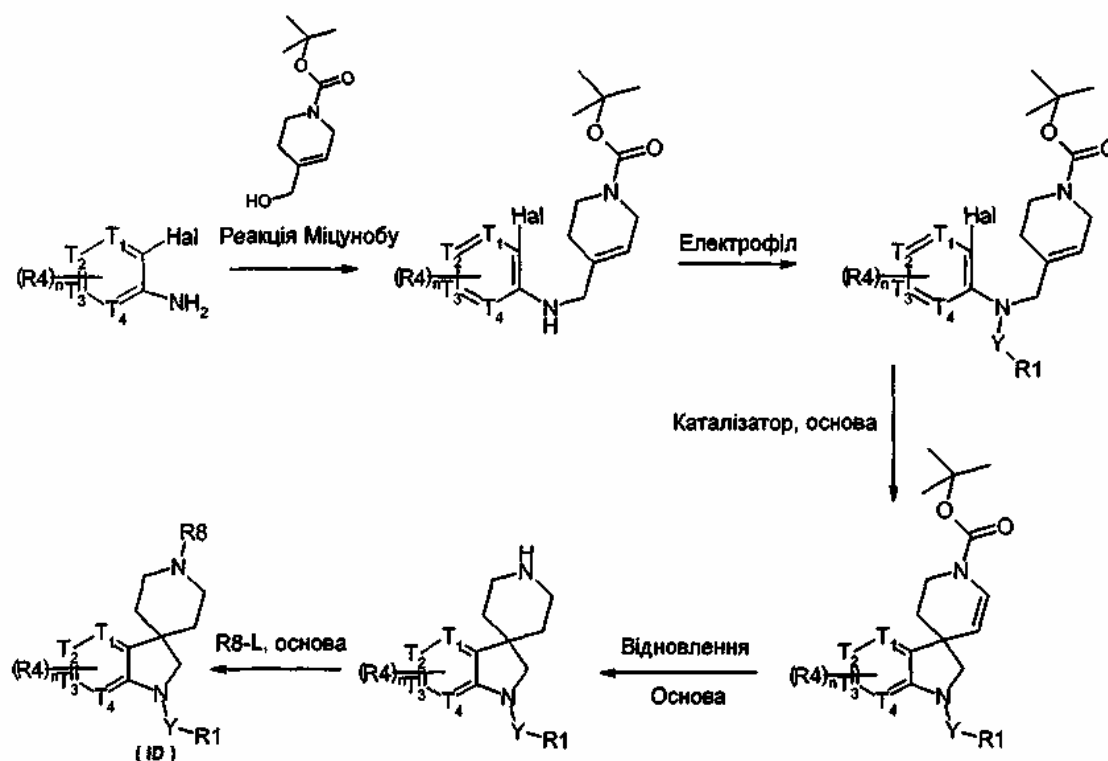


СХЕМА VI



Наведені вище методики, особливо схему V, можна змінювати відповідно до кваліфікації фахівця в даній галузі техніки. Так, наприклад, сполуки формули 1, у яких кільцем T є тіофенове кільце, можна синтезувати за методикою, описаною на схемі VII.

Так, сполуку формули ID можна синтезувати шляхом алкілювання сполуки формули 42 реагентом формули R8-L за методиками, які самі по собі відомі.

Сполуку формули 42 можна одержати за реакцією сполуки формули 43 з відновним реагентом, таким як триетилсилан, борогідрид натрію, ціаноборогідрид натрію або боран, у присутності кислоти, такої як трифтороцтова кислота, в органічному розчиннику, такому як дихлорметан при температурі від -10 до 80°C.

Сполуку формули 43 можна синтезувати зі сполуки формули 44 за реакцією з підходящими електрофільними реагентами за методиками, які самі по собі відомі.

Сполуку формули 44 можна одержати зі сполуки формули 45 шляхом обробки підходящою основою, такою як карбонат калію, при температурі від 0 до 80°C в органічному розчиннику, такому як метанол або етанол у комбінації з водою.

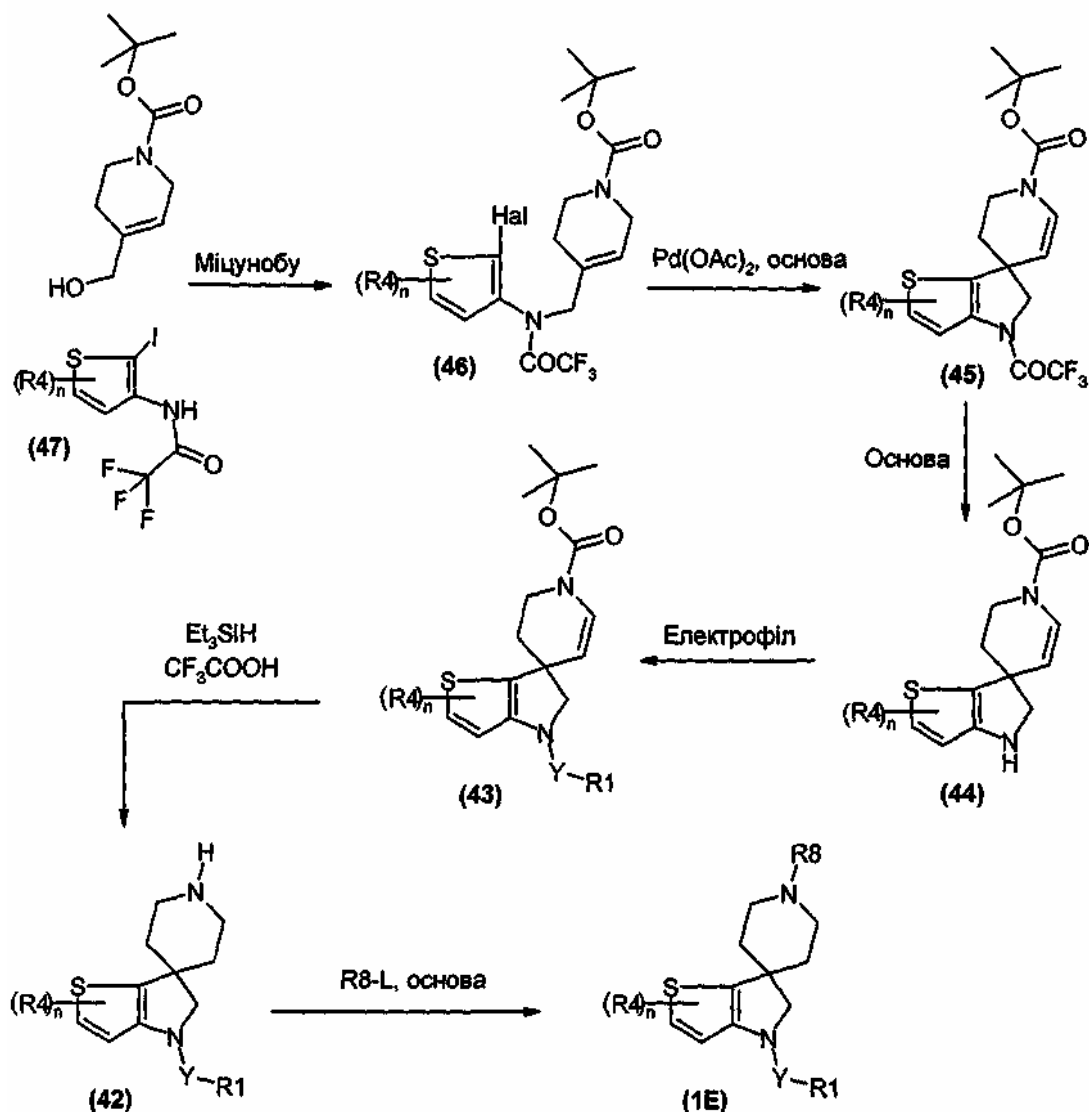
Сполуку формули 45 можна синтезувати шляхом циклізації сполуки формули 46 при умовах реакції Хека, звичайно в присутності каталізатора, такого як ацетат паладію(II), необов'язково ліганду, такого як трифенілфосфін, і/або добавки, такої як тетрабутиламонійбромід, і основи, такої як триетиламін, в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран, ацетонітрин, диметилформамід, N-метилпіролідон або диметилацетамід при температурі від 20 до 140°C.

Сполуки формули 46 можна синтезувати за реакцією сполучення сполуки формули 47 з відомим спиртом 8 [J. Org. Chem. 2001, 66, 5545-5551] при умовах реакції Міцунобу, звичайно з використанням фосфіну, такого як трифенілфосфін, і азосполуки, такої як діетилазодикарбоксилат або діізопропілазодикарбоксилат, в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран або толуол, при температурі від 0 до 80°C.

Сполуки формули 46 й 47 є відомими сполуками або їх можна одержати з відомих сполук за методиками, відомими фахівцеві в даній галузі техніки.

Деякі сполуки формули 42, 43 й 44 є новими сполуками і як такі утворюють ще один об'єкт даного винаходу.

Схема VII



Фахівець у даній галузі техніки легко зрозуміє, що способами, описаними на схемі VII, можна одержати інші сполуки формули 1.

Сполуки формули (I) можна використовувати для боротьби з навалами вказаних нижче шкідників-комах, і їх контролю, таких як лускокрилі, двокрилі, напівтвердокрилі, бахромчатокрилі, прямокрилі, таргани, твердокрилі, блохи, перетинчастокрилі й терміти, а також інші безхребетні шкідники, наприклад, кліщі, нематоди й молюски. Комахи, кліщі, нематоди й молюски далі будуть називатися шкідниками. Комахи, з якими можна боротися і яких можна знищувати шляхом застосування сполук, запропонованих у даному винаході, включають шкідників, зв'язаних із землеробством (цей термін включає вирощування врожаю для одержання харчових продуктів і продуктів з волокон), плідництвом і тваринництвом, свійськими тваринами, лісівництвом і зберіганням продуктів рослинного походження (таких як плоди, зерно й деревина); шкідників, зв'язаних з пошко-

дженням штучних споруд і передачею хвороб людині й тваринам; а також небажаних шкідників (таких як мухи).

Приклади видів шкідників, боротися з якими можна за допомогою сполук формули (I), включають: *Myzus persicae* (попелиця), *Aphis gossypii* (попелиця), *Aphis fabae* (попелиця), *Lygus* spp. (клопи), *Dysdercus* spp. (клопи), *Nilaparvata lugens* (дельфацид), *Nephotettix inciticeps* (цикадка), *Nezara* spp. (щитники), *Euschistus* spp. (щитники), *Leptocoris* spp. (щитники), *Frankliniella occidentalis* (thrips), *Thrips* spp. (трипси), *Leptinotarsa decemlineata* (колорадський жук), *Anthonomus grandis* (довгоносик бавовняний), *Aonidiella* spp. (червці), *Trialeurodes* spp. (білокрилки), *Bemisia tabaci* (білокрилка), *Ostrinia nubilalis* (метелик кукурудзяний), *Spodoptera littoralis* (гусениця совки бавовняної), *Heliothis virescens* (гусениця тютюнової листовійки-брунькоїда), *Helicoverpa armigera* (коробковий черв'як), *Helicoverpa zea* (коробковий черв'як), *Sylepta derogata* (листовійка бавовняна),

Pieris brassicae (капустяниця), *Plutella xylostella* (моль капустяна), *Agrotis* spp. (совки), *Chilo suppressalis* (свердлик рисовий стебловий), *Locusta migratoria* (сарана), *Chortiocetes terminifera* (сарана), *Diabrotica* spp. (плостіди), *Panonychus ulmi* (кліщ червоний плодовий), *Panonychus citri* (кліщик червоний цитрусовий), *Tetranychus urticae* (кліщ двоцвітний павутинний), *Tetranychus cinnabarinus* (кліщ павутинний червоний), *Phyllocoptruta oleivora* (кліщ іржастий (іржавий) цитрусовий), *Polyphagotarsonemus latus* (широкий кліщ), *Brevipalpus* spp. (плоскі кліщі), *Boophilus microplus* (кліщ боофілюс), *Dermacentor variabilis* (іксодовий кліщ собачий), *Ctenocephalides felis* (блоха котяча), *Liriomyza* spp. (мініюючі мушки), *Musca domestica* (муха кімнатна), *Aedes aegypti* (комар), *Anopheles* spp. (кровосисні комарі), *Culex* spp. (кровосисні комарі), *Lucilia* spp. (м'ясні мухи), *Blattella germanica* (тарган), *Periplaneta americana* (тарган), *Blatta orientalis* (тарган), терміти родини *Mastotermitidae* (наприклад, *Mastotermes* spp.), родини *Kalotermitidae* (наприклад *Neotermes* spp.), родини *Rhinotermitidae* (наприклад, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* й *R. santonensis*) і родини *Termitidae* (наприклад *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (вогнева мураха), *Monomorium pharaonis* (фараонів мураха), *Damalinea* spp. і *Linognathus* spp. (пухоїди й воші відповідно), *Meloidogyne* spp. (кореневі нематоди), *Globodera* spp. і *Heterodera* spp. (гетеродериди), *Pratylenchus* spp. (нематоди, які пошкоджують рослини), *Rhizopholus* spp. (бананові норові або свердловальні нематоди), *Tylenchulus* spp. (цитрусові нематоди), *Haemonchus contortus* (гемонхус), *Caenorhabditis elegans* (оцтова нематода), *Trichostrongylus* spp. (шлунково-кишкові нематоди) і *Deroceras reticulatum* (слизень).

Тому даний винахід стосується способу боротьби й контролювання комах, кліщів, нематод і молюсків, який включає нанесення інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективної кількості сполуки формули (I) або композиції, який містить і сполуку формули (I), на шкідників, на вогнище шкідників або на рослини, підданих навалі шкідників. Сполуки формули (I) переважно використовувати проти комах, кліщів або нематод.

При використанні в даному винаході термін "рослина" включає сіянці, чагарники й дерева.

Для нанесення сполуки формули (I) у вигляді інсектициду, акарициду, нематоциду або молюскоциду на шкідників, на вогнище шкідників або на рослини, підданих навалі шкідників, сполука формули (I) звичайно вносять у композицію, яка додатково до сполуки формули (I) включає підходящий інертний розріджувач або носій і необов'язково поверхнево-активну речовину (ПАР). ПАР є хімікатами, які здатні змінювати властивості межі розділу (наприклад, межі розділу рідина/тверда речовина, рідина/повітря або рідина/рідина) шляхом зниження поверхневого натягу, що приводить до змін інших властивостей (наприклад, диспергування, емульгування й змочування). Переважно, щоб всі композиції (і тверді, і рідкі рецептури) включали, у мас.%, від 0,0001 до 95%, більш переважно -

від 1 до 85%, наприклад, від 5 до 60% сполуки формули (I). Композицію звичайно застосовують для боротьби зі шкідниками таким чином, щоб сполука формули (I) наносилася в кількості, що становить від 0,1г до 10кг на гектар, переважно - від 1г до 6кг на гектар, більш переважно - від 1г до 1кг на гектар.

При використанні для протруювання насіння сполука формули (I) застосовується в кількості, що становить від 0,0001 до 10г (наприклад, 0,001г або 0,05г), переважно - від 0,005 до 10г, більш переважно - від 0,005 до 4г на 1кг насіння.

Інший варіант виконання даного винаходу стосується інсектицидної, акарицидної, нематоцидної або молюскоцидної композиції, яка включає інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективну кількість сполуки формули (I) і її підходящий носій або розріджувач. Композиція переважно є інсектицидною, акарицидною, нематоцидною або молюскоцидною композицією.

Ще один варіант виконання даного винаходу стосується способу боротьби зі шкідниками у вогнищі, який включає обробку шкідників або вогнища шкідників за допомогою інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективної кількості композиції, який містить сполуку формули (I). Сполуки формули (I) переважно використовувати проти комах, кліщів або нематод.

Композиції можна вибрати із цілого ряду рецептур, включаючи порошки для запилення (ПЗ), розчинні порошки (РП), розчинні у воді гранули (ВГ), гранули, які диспергуються у воді (ДГ), змочувані порошки (ЗП), гранули (ГР) (з повільним або швидким виділенням), розчинні концентрати (РК), рідини, які змішуються з маслом (МР), рідини надмалого об'єму (РН), емульгувальні концентрати (ЕК), диспергувальні концентрати (ДК), емульсії (і масло-у-воді (ЕМ), і масло-у-маслі (ЕВ)), мікроемульсії (МЕ), концентрати суспензій (СК), аерозолі, рецептури для дрібнокраплинного обприскування/фумігації, капсульовані суспензії (КС) і рецептури для обробки насіння. Вибраний тип композиції в кожному разі буде залежати від конкретного призначення й фізичних, хімічних і біологічних характеристик сполуки формули (I).

Порошки для запилення (ПЗ) можна одержати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів (наприклад, природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, оксидом алюмінію, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, діатомовою землею, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію й магнію, сіркою, гідроксидом кальцію, різними типами борошна, тальком й іншими органічними й неорганічними твердими носіями) і механічного розмелювання суміші в тонкоподрібнений порошок.

Розчинні порошки (РП) можна одержати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю розчинних у воді неорганічних солей (таких як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) або з одним або більшою кількістю розчинних у воді органічних твердих речовин (таких як полісахарид) і, необов'язково, з одним або більшою кількістю змочувальних агентів, з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів або сумішшю таких агентів для поліпшення

диспергованості/розчинності у воді. Потім суміш розмелюють у тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з одержанням розчинних у воді гранул (ВГ).

Змочувані порошки (ЗП) можна одержати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів або носіїв, з одним або більшою кількістю змочувальних агентів, з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів й, необов'язково, з одним або більшою кількістю суспендуючих агентів для полегшення диспергування в рідинах. Потім суміш розмелюють у тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з одержанням гранул, які диспергуються у воді (ВГ).

Гранули (ГР) можна одержати або шляхом гранулювання суміші сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю порошкоподібних твердих розріджувачів або носіїв, або з попередньо сформованих гранул, які не містять активного інгредієнта, шляхом абсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в підходящому агенті) у пористому гранульованому матеріалі (такому як пемза, атапультові глини, фулєрова земля, кізельгур, діатомова земля або розмелені кукурудзяні качани) або шляхом адсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в підходящому агенті) у твердому наповнювачі (такому як пісок, силікати, неорганічні карбонати, сульфати або фосфати) із проведенням сушіння якщо буде потреба. Агенти, які звичайно застосовуються для сприяння абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні й ароматичні нафтові розчинники, спирти, прості ефіри, кетони й складні ефіри) і агенти, що склеюють (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри й рослинні олії). У гранули також можна включити одну або більшу кількість інших добавок (наприклад, емульгуючий агент, змочувальний агент або диспергуючий агент).

Диспергувальні концентрати (ДК) можна одержати шляхом розчинення сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або простий ефір гліколю. Ці розчини можуть містити поверхнево-активну речовину (наприклад, для поліпшення розведення водою або запобігання кристалізації в баці для обприскування).

Емульгуювальні концентрати (ЕК) або емульсії масло-у-воді (ЕМ) можна одержати шляхом розчинення сполуки формули (I) в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або більшу кількість змочувальних агентів, один або більшу кількість емульгуючих агентів або суміш таких агентів). Підходящі для використання в ЕК органічні розчинники включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 й SOLVESSO 200; SOLVESSO є зареєстрованим товарним знаком), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) і спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід жирної кислоти C₈-C₁₀) і хлоровані вуглеводні. Готовий ЕК може мимовільно емульгуватися при додаванні до води з утворенням емульсії, яка має достатню стабільність, щоб за допо-

могою підходящого обладнання було можливо проводити обприскування. Одержання ЕМ включає одержання сполуки формули (I) у вигляді рідини (якщо при кімнатній температурі вона не є рідиною, то її можна розплавити при підходящій температурі, звичайно нижче 70°C) або розчину (шляхом розчинення в підходящому розчиннику) з наступним емульгуванням отриманої рідини або розчину у воді, який містить одну або більшу кількість ПАР, при великому зсувному зусиллі, з одержанням емульсії. Підходящі для використання в ЕМ розчинники включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) і інші підходящі органічні розчинники, які мають низьку розчинність у воді.

Мікроемульсії (МЕ) можна одержати шляхом змішування води із сумішшю одного або більшої кількості розчинників з одним або більшою кількістю ПАР для забезпечення мимовільного утворення термодинамічно стабільної ізотропної рідини. Сполука формули (I) спочатку міститься або у воді, або в суміші розчинник/ПАР. Підходящі для використання в МЕ розчинники включають описані вище для застосування в ЕК або ЕМ. МЕ може являти собою систему масло-у-воді або вода-у-маслі (визначити тип наявної системи можна шляхом вимірювання електропровідності) і вона може бути підходящою для змішування розчинних у воді й розчинних у маслі пестицидів в одній і тій же рецептурі. МЕ придатна для розведення водою, у якій вона залишається мікроемульсією або утворює звичайну емульсію масло-у-воді.

Концентрати суспензій (СК) можуть включати водні або неводні суспензії тонкоподрібнених твердих частинок сполуки формули (I). СК можна одержати шляхом розмелу на кульовому або бісерному млині твердої сполуки формули (I) у підходящому середовищі, необов'язково з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів й одержати тонкоподрібнену суспензію сполуки. У композицію можна включити один або більшу кількість змочувальних агентів і можна включити суспендувальний агент для зниження швидкості осідання частинок. Альтернативно, сполуку формули (I) можна піддати сухому розмелюванню й додати до води, яка містить описані вище агенти, і одержати шуканий готовий продукт.

Аерозольні рецептури включають сполуку формули (I) і підходящий пропелент (наприклад, н-бутан). Сполука формули (I) також можна розчинити або диспергувати у підходящому середовищі (наприклад, у воді або рідині, яка змішується з водою, такою як н-пропанол) і одержати композиції для використання в ємностях для розпилення, які не знаходяться під тиском і які діють за допомогою ручних pomp.

Сполука формули (I) можна в сухому вигляді змішати з піротехнічною сумішшю й одержати композицію, придатну для утворення в закритому просторі диму, який містить сполуку.

Капсульовані суспензії (КС) можна одержати способом, подібним до способу одержання рецептур ЕМ, але із включенням додаткової стадії полімеризації, так щоб утворилася водна дисперсія крапельок масла, у якій кожна крапелька масла

капсульована за допомогою полімерної оболонки й містить сполуку формули (I) і необов'язково її носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна одержати за допомогою міжфазної реакції поліконденсації або за методикою коацервації. Композиції можуть використовуватися для регульованого виділення сполуки формули (I) і їх можна використовувати для обробки насіння. Сполуку формули (I) також можна включити в полімерну матрицю, яка біологічно розкладається, і забезпечити повільне, регульоване виділення сполуки.

Композиція може включати одну або більшу кількість добавок для поліпшення біологічних робочих характеристик композиції (наприклад, шляхом поліпшення змочування, утримання або розподілу на поверхнях; стійкості до впливу дощу на оброблені поверхні; або всмоктування або рухомості сполуки формули (I)). Такі добавки включають поверхнево-активні речовини, добавки для обприскування на основі масел, наприклад, деяких мінеральних масел або натуральних рослинних олій (таких як соєва олія й рапсова олія), і їх суміші з іншими посилюючий біологічний вплив допоміжними речовинами (інгредієнтами, які можуть сприяти впливу сполуки формули (I) або змінювати її вплив).

Сполуку формули (I) також можна приготувати для застосування як засіб обробки насіння, наприклад, у вигляді порошкоподібної композиції, такий як порошок для сухої обробки насіння (ПС), розчинний у воді порошок (ВП) або порошок, який диспергується у воді, для обробки суспензією (ДП), або у вигляді рідкої композиції, такий як текучий концентрат (ТК), розчин (РС) або капсульована суспензія (КС). Одержання композицій ПС, ВП, ДП, ТК і РС є дуже подібним до одержання описаних вище композицій ПЗ, РП, ЗП, СК і ДК відповідно. Композиції для обробки насіння можуть включати агент, який сприяє адгезії композиції до насіння (наприклад, мінеральне масло або плівкоутворювальна захисна речовина).

Змочувальні агенти, диспергуючі агенти й емульгуючі агенти можуть являти собою ПАР катіоногенного, аніоногенного, амфотерного або неіоногенного типу.

Підходящі ПАР катіоногенного типу включають четвертинні амонієві сполуки (наприклад, цетилметиламонійбромід), імідазоліни й солі амінів.

Підходящі аніоногенні ПАР включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноєфірів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутіл-нафталінсульфонат і суміші діізопропіл- і триізопропілнафталінсульфонатів натрію), сульфати простих ефірів, сульфати простих ефірів спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), карбоксилати простих ефірів (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), фосфатні складні ефіри (продукти реакції одного або більшої кількості жирних спиртів з фосфорною кислотою (переважно складні моноєфіри) або з пентаоксидом фосфору (переважно складні дієфіри), наприклад, продукти реакції лаурилового спирту з тетрафосфорною кислотою; ці продукти також можуть бути етокси-

льовані), сульфосукцинамат, сульфонати парафінів або олефінів, таурати й лігносульфонати.

Підходящі ПАР амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати й гліцинати.

Підходящі ПАР неіоногенного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид, або їх сумішей з жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); часткові складні ефіри, отримані з жирних кислот з довгими ланцюгами або ангідридів гекситу; продукти конденсації вказаних часткових складних ефірів з етиленоксидом; блоки-полімери (які включають етиленоксид і пропіленоксид); алканоламіни; звичайні складні ефіри (наприклад, поліетиленгліколеві ефіри жирних кислот); оксиди амінів (наприклад, лаурилдиметиламіноксид); і лецитини.

Підходящі суспендуючі агенти включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або натрієва сіль карбоксиметилцелюлози) і глини, які набухають (такі як бентоніт або атапульгіт).

Сполуку формули (I) можна вносити будь-якими відомими способами нанесення пестицидних сполук. Наприклад, її можна нанести, одну або в композиції, на шкідників або на вогнище шкідників (таке як місце перебування шкідників або на вирощувану рослину, піддана зараженню шкідниками), на будь-яку частину рослини, включаючи листя, стебла, гілки або корені, на насіння перед їх висіванням або на інші середовища, у яких виростає або повинна бути посіяна рослина (такі як ґрунт, який оточує коріння, ґрунт у цілому, вода для затоплення або гідропонні системи вирощування) безпосередньо або її можна вносити шляхом розбризкування, запилення, наносити зануренням, вносити у вигляді рецептури, яка представляє собою крем або пасту, вносити у вигляді пари або вносити шляхом розподілу композиції (такий як гранульована композиція або композиція, упакована в розчинний у воді пакет) у ґрунті або у водному середовищі або включення в неї.

Сполуку формули (I) також можна ввести в рослини шляхом ін'єкції або обприскування рослинного покриву з використанням електродинамічних методик обприскування або інших малооб'ємних методик або внести за допомогою наземних або авіаційних систем зрошення.

Композиції для застосування як водні препарати (водних розчинів або дисперсій) звичайно поставляються у вигляді концентрату, який містить значну частку активного інгредієнта, і перед застосуванням концентрат додають до води. Ці концентрати, які можуть являти собою ДК, СК, ЕК, ЕМ, МЕ ВГ, РП, ЗП, ДГ і КС, часто повинні витримувати зберігання протягом тривалих періодів часу й після такого зберігання після додатка до води повинні бути здатні утворювати водні препарати, які залишаються однорідними протягом часу, достатнього для того, щоб їх можна було вносити за допомогою звичайного встаткування для розбризкування. Такі водні препарати можуть містити різні кількості сполуки формули (I) (наприклад, від

0,0001 до 10мас.%) залежно від мети їх застосування.

Сполуку формули (I) можна застосовувати в сумішах з добривами (наприклад, азот-, калій- або фосфорвмісними добривами). Підходящі типи рецептур включають гранули добрива. Переважно, щоб суміші містили до 25мас.% сполуки формули (I).

Тому даний винахід також стосується композиції добрива, яка містить добриво й сполуки формули (I).

Композиції, запропоновані в даному винаході, можуть містити інші сполуки, які мають біологічну активність, наприклад, мікродобрива або сполуки, які мають подібну або комплементарну фунгіцидну активність або які мають регулюючу ріст рослини, гербицидну, інсектицидну, нематоцидну або акарицидну активність.

Сполука формули (I) може бути єдиним активним інгредієнтом композиції або вона може бути змішана з одним або більшою кількістю додаткових активних інгредієнтів, таких як пестицид, фунгіцид, синергетик, гербицид або регулятор росту рослин, якщо це доцільно. Додатковий активний інгредієнт може давати композицію, яка має більш широкий спектр активності або підвищену стійкість у вогнищі поширення; підсилювати вплив або доповнювати вплив (наприклад, шляхом збільшення швидкості впливу або подолання несприйнятливості) сполуки формули (I); або сприяти подоланню або попередженню розвитку резистентності по відношенню до окремих компонентів. То, який конкретний додатковий активний інгредієнт буде використовуватися, залежить від призначення композиції. Прикладами підходящих пестицидів є наступні:

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

б) Фосфорорганічні сполуки, такі як профенофос, сулпрофос, ацефат, метилпаратіон, азинфосметил, деметон-s-метил, гемтенофос, тіометон, фенаміфос, монокротофос, профенофос, триазофос, метамідофос, диметоат, фосфамідон, малаціон, хлорпірифос, фосалон, тербуфос, фенсульфотіон, фонофос, форат, фоксим, піриміфосметил, піриміфос-етил, фенітротіон, фостіазат і діазинон;

с) Карбамати (включаючи арилкарбамати), такі як піримікарб, тіазамат, клоетокарб, карбофуран, фуратіокарб, етіофенкарб, алдікарб, тіофурокс, карбосульфат, бендіокарб, фенобукарб, пропоксур, метомил й оксаміл;

д) Бензоїлсечовини, такі як дифлубензурон, трифлумурон, гексафлумурон, флуфеноксурон і хлорфлуазурон;

е) Органічні сполуки олова, такі як цигексатин, фенбутатиноксид й азоциклотин;

ф) Піразоли, такі як тебуфенпірад і фенпіроксимат;

г) Макроліди, такі як авермектини й мілбеміцин, наприклад, абамектин, емабектинбензоат, івермектин, мілбеміцин, спіносад й азадирахтин;

h) Гормони й феромони;

i) Хлорорганічні сполуки, такі як ендосульфат, бензолгексахлорид, ДДТ, хлордан і диелдрин;

j) Амідини, такі як хлордимеформ й амитраз;

к) Фуміганти, такі як хлорпікрин, дихлорпропан, метилбромід і метам;

l) Хлорнікотинільні сполуки, такі як імідаклоп-рид, тіаклоп-рид, ацетаміп-рид, нітенпірам і тіаметоксам;

m) Діацилгідразини, такі як тебуфенозид, хромафенозид і метоксифенозид;

n) Дифенілові ефіри, такі як діофенолан і пірипроксифен;

o) Індоксакарб;

p) Хлорфенапір; і

q) Піметрозин.

Додатково до основних класів пестицидів, перерахованих вище, у композиціях можна використовувати інші пестициди, які впливають на певних шкідників, якщо це доцільно для призначення композиції. Наприклад, можна використовувати інсектициди, селективні для конкретних культур, наприклад, інсектициди, специфічні по відношенню до стеблових свердлильників (такі як картап) або специфічні для комор інсектициди (такі як бупрофезин) для застосування для рису. Альтернативно, у композицію також можна включати інсектициди або акарициди, специфічні для конкретних видів/стадій розвитку комах (наприклад, акарицидні оволарвіциди, такі як клофентезин, флукбензімін, гекситіазокс або тетрадіфон; акарицидні мо-тиліциди, такі як дикофол або пропаргіт; акарициди, такі як бромпропілат або хлорбензилат; або регулятори росту, такі як гідраметиллон, циромазин, метопрен, хлорфлуазурон або дифлубензурон).

Прикладами фунгіцидних сполук, які можна включати в композицію, запропоновану в даному винаході, є (E)-N-метил-2-[2-(2,5-диметилфеноксиметил)феніл]-2-метоксиіміноацетамід (SSF-129), 4-бром-2-ціано-N,N-диметил-6-трифторметилбензімідазол-1-сульфонамід, α-[N-(3-хлор-2,6-ксіліл)-2-метоксиацетамідо]-γ-бутиролактон, 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-п-толілімідазол-1-сульфонамід (IKF-916, ціанамідазосульфамід), 3-5-дихлор-N-(3-хлор-1-етил-1-метил-2-оксопропіл)-4-метилбензамід (RH-7281, зоксамід), N-аліл-4,5-диметил-2-триметилсілілітіофен-3-карбоксамід (MON65500), N-(1-ціано-1,2-диметилпропіл)-2-(2,4-дихлорфенокси)пропіонамід (AC382042), N-(2-метокси-5-піридил)-циклопропанкарбоксамід, ацибензолар (CGA245704), аланікарб, алдіморф, анілазин, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноміл, білоксазол, бітертанол, бластицидин S, бромуконазол, бупіримат, каптафол, каптан, карбендіазим, карбендіазимхлоргідрат, карбоксин, карпропамід, карвон, CGA41396, CGA41397, хінометіонат, хлорбензтіазон, хлороталоніл, хлорозолінат, клозілакон, сполуки, які містять мідь, такі як оксихлорид міді(II), оксихінолат міді(II), сульфат міді(II), таллат міді(II) і бордоська рідина, ціамідазосульфамід, ціазофамід (IKF-916), цимоксаніл,

ципроконазол, ципродиніл, дебакарб, ди-2-піридилдисульфід-1,1'-діоксид, дихлофлуанід, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, дифенокназол, дифензокват, дифлуметорим, О,О-діізопропіл-5-бензилтіофосфат, димефлуазол, диметконазол, диметоморф, диметиримол, диніконазол, динокап, дитіанон, додецилдиметиламонійхлорид, додеморф, додин, догуадин, едифенфос, епоксиконазол, етиримол, етил-(Z)-N-бензил-N[(метил(метилтіоетиліденамінооксикарбоніл)амін o]тіо)-β-аланінат, етридіазол, фамоксадон, фенамідон (RPA407213), фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід (KBR2738), фенпиклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуметовер, флуороїмід, флуквінконазол, флусилазол, флутоланіл, флутриафол, фолпет, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гуазатин, гексаконазол, гідроксіізоксазол, гимексасол, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинтриацетат, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб (SZX0722), ізопропанілбутилкарбамат, ізопротіолан, касугаміцин, крезоксим-метил, LY186054, LY211795, LY248908, манкозеб, манеб, мефеноксам, мепаніпірим, мепроніл, металаксил, метконазол, метирам, метирам-цинк, метоміностробін, міклобутаніл, неоасозин, диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуаримол, офурац, ртутьорганічні сполуки, оксаксидил, оксасульфурон, оксолінова кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенкікурон, феназиноксид, фосетил-А1, фосфорвімісні кислоти, фталід, пікоксистробін (ZA1963), поліюксин D, полірам, пробеназол, прохлораз, процімідон, пропамокарб, пропіконазол, пропінеб, пропіонова кислота, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, піроквілон, піроксифур, піролінтрин, четвертинні амонієві сполуки, хінометіонат, хіноксифен, хінтозен, сипконазол (F-155), пентахлорфенат натрію, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, тебуконазол, теклофталам, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, 2-(тіоціанметилтіо)бензотіазол, тіофанат-метил, тирам, тимібенконазол, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін (CGA279202), трифорин, трифлумізол, тритиконазол, валідаміцин А, валам, вінклозолін, зинеб і зирам.

Сполуки формули (I) можна змішувати із ґрунтом, торфом або іншими середовищами для вкорінення з метою захисту рослин від розповсюджуваних насіннями, переданих через ґрунт або листові грибкові хвороби.

Приклади синергістів, які підходять для застосування в композиціях, включають піперонілбутоксид, сесамекс, сафроксан і додецилімідазол.

То, які гербіциди й регулятори росту рослин виявляються підходящими для включення в композиції, буде залежати від об'єкта впливу й необхідного ефекту.

Прикладом селективного гербіциду для рису, якому можна включити, є пропаніл. Прикладом регулятора росту рослин, призначеного для бавовни, є РІХ™.

Деякі суміші можуть включати активні інгредієнти, які мають істотно інші фізичні, хімічні або біо-

логічні характеристики, так що самі по собі вони нелегко включаються в такий же звичайний тип рецептури. У таких випадках можна одержати інші типи рецептур. Наприклад, якщо один активний інгредієнт представляє собою нерозчинну у воді тверду речовину, а інший - нерозчинну у воді рідину, все-таки можна диспергувати кожен активний інгредієнт в одній і тій же безперервній водній фазі шляхом диспергування твердого активного інгредієнта у вигляді суспензії (з використанням методики, аналогічної до застосовуваної для одержання СК), але диспергування рідкого активного інгредієнта у вигляді емульсії (з використанням методики, аналогічної до застосовуваної для одержання ЕМ). Отримана композиція представляє собою рецептуру суспензія-емульсія (СЕ).

Даний винахід ілюструється наведеними нижче прикладами:

Приклад 1

Цей приклад ілюструє одержання сполуки CCCIII-3, 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)спіро[індолін-3,4'-піперидину]

Стадія А:

NaH (4,25г) повільно додавали до розчину 3-хлор-2-піридилацетонітрилу (10г) у ДМСО (диметилсульфоксид) (140мл) в атмосфері азоту. Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Додавали розчин трет-бутилового ефіру біс-(2-хлоретил)-карбаїнової кислоти (15,87г) у ДМСО (140мл) і отриману суміш перемішували при 70°C протягом 2 год. Після охолодження реакційної суміш піддавали розподілу між етилацетатом і водою, об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію й розсоллом, сушили (над сульфатом натрію), фільтрували й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії [SiO₂; етилацетат-гексан (3:7)] й одержували 12,96г (61%) трет-бутилового ефіру 2-хлор-4'-ціано-3',4',5',6'-тетрагідро-2'H-[3,4']біпіридиніл-1'-карбонілової кислоти у вигляді білої твердої речовини; МС (мас-спектроскопія) (ES⁺) 322/324 (M+H⁺).

Стадія В:

Суміш трет-бутилового ефіру 2-хлор-4'-ціано-3',4',5',6'-тетрагідро-2'H-[3,4']біпіридиніл-1'-карбонілової кислоти (6г) і три-трет-бутоксіалюмогідриду літію (72,34мл), 1М розчин у ТГФ (тетрагідрофуран)) в 1-4-діоксані (90мл) кип'ятили зі зворотним холодильником протягом ночі. Після охолодження при 0°C повільно додавали 1н. NaOH (100мл) і Н₂O (100мл). До суміші додавали дихлорметан. Водну фазу двічі екстрагували дихлорметаном й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом магнію), фільтрували й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії [SiO₂; дихлорметан-метанол (95:5)] й одержували 5,5г (46%) трет-бутилового ефіру 7-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонілової кислоти; МС (ES⁺) 290 (M+H⁺).

Стадія С:

Суміш 2-хлорізонікотинової кислоти (441мг), тіонілхлориду (0,6мл), ДМФ (диметилформамід) (слідова кількість) у толуолі (9мл) кип'ятили зі зво-

ротним холодильником протягом 2 год. Після концентрування у вакуумі залишок розчиняли в 12 мл дихлорметан і по краплях додавали при 0°C в атмосфері азоту до суміші трет-бутилового ефіру 7-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (405 мг), триетиламіну (0,86 мл) і дихлорметану (12 мл). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2 год. Суміш розбавляли насиченим розчином карбонату натрію. Органічний шар відокремлювали й водну фазу двічі екстрагували дихлорметаном й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом магнію), фільтрували й концентрували у вакуумі й одержували 630 мг трет-бутилового ефіру 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти спіро[індолін-3,4'-піперидин; МС (ES+) 429 (M+H⁺).

Стадія D:

Трифтороцтову кислоту (1,92 мл) при перемішуванні додавали до розчину 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти трет-бутилового ефіру спіро[індолін-3,4'-піперидин] (0,62 г) у безводному дихлорметані (20 мл) в атмосфері азоту. Реакційну суміш витримували протягом 2 год. Реакційну суміш промивали насиченим розчином бікарбонату й сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі й одержували 427 мг (90%) 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидин]; МС (ES+) 329 (M+H⁺).

Стадія E:

Розчин 4-хлорцинамілхлориду (68 мг) в ацетонітрилі (4 мл) при перемішуванні повільно додавали до суміші 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидин] (100 мг) і карбонату калію (0,42 г) в ацетонітрилі (16 мл) в атмосфері азоту при кімнатній температурі. Реакційну суміш нагрівали при 70°C протягом 2 год. Реакційну суміш розбавляли діетиловим ефіром, промивали за допомогою H₂O і сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії [SiO₂; гексан-етилацетат-триетиламін (2:8:0,1)] й одержували 84 мг (58%) 7-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)]спіро[індолін-3,4'-піперидин]; МС (ES+) 479 (M+H⁺).

Сполуки №№ CCCI-3, CCCV-3 й CCCVI-3 одержували за методиками, аналогічним до описаних у прикладі 1.

Приклад 2

Цей приклад ілюструє одержання сполуки CCI-II-3, 6-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)]спіро[індолін-3,4'-піперидин].

Стадія A:

Гексаметилдисилазанат калію (1,2 мл, 0,5 М розчин у толуолі) при кімнатній температурі в атмосфері азоту повільно додавали до розчину 4-хлор-3-фторпіридину (0,5 г) і N-Вос-4-ціанопіридину (0,312 г) в 1,5 мл толуолу. Суміш перемішували при 80°C протягом 2 год. Після охолодження реакцію зупиняли за допомогою 1 н. HCl. Водну фазу двічі екстрагували толуолом й об'єднані органічні шари сушили над безводним сульфатом магнію й концентрували у вакуумі. Неочи-

щений продукт очищали за допомогою хроматографії [SiO₂; етилацетат-гексан (1:1)] й одержували 104 мг (90%) трет-бутилового ефіру 4-ціано-3'-фтор-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-[4,4']біпіридиніл-1-карбонової кислоти; МС (ES+) 306 (M+H⁺).

Стадія B:

Суміш трет-бутилового ефіру 4-ціано-3'-фтор-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-[4,4']біпіридиніл-1-карбонової кислоти (1 г) і три-трет-бутоксіалюмогідриду літію (12,7 мл), 1 М розчин у ТГФ) в 1-4-діоксані (15 мл) перемішували при 130°C (у запаяній трубці) протягом 1 год. Після охолодження при 0°C повільно додавали 1 н. NaOH (100 мл) і H₂O (100 мл). До суміші додавали етилацетат. Водну фазу двічі екстрагували етилацетатом й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом магнію), фільтрували й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії [SiO₂; гексан-етилацетат (7:3)] й одержували 230 мг (24%) трет-бутилового ефіру 6-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти; МС (ES+) 290 (M+H⁺).

Стадія C:

Суміш 2-хлорізонікотинової кислоти (239 мг), тіонілхлориду (0,33 мл), ДМФ (слідове кількість) у толуолі (5 мл) кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 2 год. Після концентрування у вакуумі залишок розчиняли в 2 мл дихлорметан і по краплях додавали при 0°C в атмосфері азоту до суміші трет-бутилового ефіру 6-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (220 мг), триетиламіну (0,47 мл) і дихлорметану (13 мл). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Суміш розбавляли насиченим розчином карбонату натрію. Органічний шар відокремлювали й водну фазу двічі екстрагували дихлорметаном й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом магнію), фільтрували й концентрували у вакуумі й одержували 340 мг трет-бутилового ефіру 6-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти спіро[індолін-3,4'-піперидин]; МС (ES+) 429 (M+H⁺).

Стадія D:

Трифтороцтову кислоту (1 мл) при перемішуванні в атмосфері азоту додавали до розчину трет-бутилового ефіру 6-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти спіро[індолін-3,4'-піперидин] (0,33 г) у безводному дихлорметані (10 мл). Реакційну суміш витримували протягом 2 год. Реакційну суміш промивали насиченим розчином бікарбонату й сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі й одержували 210 мг (83%) 4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидин]; МС (ES+) 329 (M+H⁺).

Стадія E:

Розчин 4-хлорцинамілхлориду (40 мг) в ацетонітрилі (3 мл) при перемішуванні в атмосфері азоту при кімнатній температурі повільно додавали до суміші 4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидин] (100 мг) і N,N-діізопропілетиламіну (0,66 мл) в ацетонітрилі (13 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнат-

ній температурі протягом 2 год, кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 2 год і потім перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш розбавляли діетиловим ефіром, промивали за допомогою H_2O , потім розсолем і сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії $[SiO_2; \text{етилацетат-метанол-триетиламін (9:10:0,1)}]$ й одержували 72 мг (76% за 3 стадії) 6-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)спіро[індолін-3,4'-піперидину]]; MC (ES+) 479 (M+H⁺).

Сполуки №№ CCIII-6 й CCIII-7 одержували за методиками, аналогічним до описаних у прикладі 2.

Приклад 3

Цей приклад ілюструє одержання сполуки III-210, 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)спіро [індолін-3,4'-піперидину]]

Стадія А:

Гексаметилдисилазанат калію (1,34 мл, 0,5 М розчин у толуолі) при 0°C в атмосфері азоту повільно додавали до розчину 5-хлор-2,3-дифторпіридин (0,1 г) і N-Вос-4-ціанопіперидину (0,14 г) в 3 мл толуолу. Суміш перемішували при 0°C протягом 1 год. Після охолодження реакцію зупиняли за допомогою 1 н. HCl. Водну фазу двічі екстрагували етилацетатом й об'єднані органічні шари промивали водою, сушили над безводним сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії $[SiO_2; \text{гексан-етилацетат-гексан (4:1)}]$ й одержували 111 мг (49%) трет-бутилового ефіру 5-хлор-4'-ціано-3-фтор-3',4',5',6'-тетрагідро-2'H-[2,4']біпіридиніл-1'-карбонової кислоти; MC (ES+) 240 (M+H⁺).

Стадія В:

Суміш трет-бутилового ефіру 5-хлор-4'-ціано-3-фтор-3',4',5',6'-тетрагідро-2'H-[2,4']біпіридиніл-1'-карбонової кислоти (0,05 г) і три-трет-бутоксіалюмогідриду літію (0,57 мл), 1 М розчин у ТГФ) в 1-4-діоксані (0,75 мл) кип'ятили зі зворотним холодильником в атмосфері азоту протягом 4 год. Після охолодження до суміші при 0°C повільно додавали 1 н. NaOH й H_2O й етилацетат. Водну фазу двічі екстрагували етилацетатом й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом натрію), фільтрували й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії $[SiO_2; \text{гексан-етилацетат-триетиламін (75:25:1)}]$ й одержували 18 мг (38%) трет-бутилового ефіру 6-хлор-4-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти; MC (ES+) 324 (M+H⁺).

Стадія С:

Суміш 2-хлорізонікотинової кислоти (324 мг), тіонілхлориду (0,43 мл), ДМФ (слідова кількість) у толуолі (6,4 мл) кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 2 год. Після концентрування у вакуумі залишок розчиняли в 2 мл дихлорметану й при 0°C в атмосфері азоту по краплях додавали до суміші трет-бутилового ефіру 6-хлор-4-аза-спіро[індолін-3,4'-піперидин]-1'-карбонової кислоти (220 мг), триетиламіну (0,6 мл) і дихлорметану

(20 мл). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Суміш розбавляли насиченим розчином карбонату натрію. Органічний шар відокремлювали й водну фазу двічі екстрагували дихлорметаном й об'єднані органічні шари промивали насиченим розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом магнію), фільтрували й концентрували у вакуумі й одержували 473 мг (102%) трет-бутилового ефіру 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти спіро[індолін-3,4'-піперидин];

MC (ES+) 407 (M - Me₂C=CH₂+H⁺).

Стадія D:

Трифтороцтову кислоту (1,47 мл) при перемішуванні додавали до розчину трет-бутилового ефіру 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-карбонової кислоти спіро[індолін-3,4'-піперидин] (0,47 г) у безводному дихлорметані (15 мл) в атмосфері азоту. Реакційну суміш витримували протягом 1 год. Реакційну суміш промивали насиченим розчином бікарбонату й сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі й одержували 363 мг (98%) 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидину]; MC (ES+) 363 (M+H⁺).

Стадія Е:

Розчин 4-хлорціанамілхлориду (165 мг) в ацетонітрилі (20 мл) при перемішуванні повільно додавали до суміші 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-спіро[індолін-3,4'-піперидину] (300 мг) і N,N-діізопропілетиламіну (0,66 мл) в ацетонітрилі (40 мл) в атмосфері азоту при кімнатній температурі. Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 4 год і кип'ятили зі зворотним холодильником протягом ночі. Реакційну суміш розбавляли діетиловим ефіром, промивали за допомогою H_2O , потім розсолем і сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії $[SiO_2; \text{гексан-етилацетат-триетиламін (8:2:0,1)}]$ й одержували 310 мг (73%) 6-хлор-4-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)-карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфенілаліл)спіро[індолін-3,4'-піперидину]]; MC (ES+) 513 (M+H⁺).

Сполуки №№ I-26, I-29, I-30, I-210, I-213, I-214, I-233, I-237, II-26, II-29, II-30, II-210, II-213, II-214, III-3, III-6, III-7, III-26, III-29, III-30, III-210, III-210 N-оксид, III-213, III-214, III-233, III-236, III-237, III-302, III-325, III-328, III-329, V-26, V-29, V-30, V-209, V-210, V-213, V-214, V-233, V-236, V-237, V-509, VIII-26, VIII-29, VIII-30, VIII-210, VIII-213, VIII-214, XX-26, XX-29, XX-30, XX-210, XX-213, XX-214, XX-233, XX-236, XX-237, CIII-49, CIII-52, CIII-53, CIII-210, CIII-214, CIII-555, CCCI-3, CCCIII-26, CCCIII-29, CCCIII-30, CCCV-26, CCCV-29 й CCCV-30 одержували за методиками, аналогічними до описаних у прикладі 3.

Приклад 4

Цей приклад ілюструє одержання сполуки DCIII-3,4-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфеніл)аліл]спіро[5,6-дигідро-4H-тіено[3,2-б]пірол-6,4'-піперидину]]

Стадія А: Трифенілфосфін (2,29 г) розчиняли в тетрагідрофурані (50 мл) і розчин охолоджували до -10°C в атмосфері аргону. Протягом 10 хв по краплях додавали діізопропілазодикарбоксилат

(1,70мл) і отриману суміш перемішували при -10°C протягом 20хв (утворювався білий осад). Додавали 2,2,2-трифтор-N-(2-йодтіофен-3-іл)-ацетамід (2,25г), розчинений у мінімальному об'ємі тетрагідрофурану, а потім 4-трет-бутиловий ефір гідроксиметил-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти [J. Org. Chem. 2001, 66, 5545-5551, 1,49г] розчинений у мінімальному об'ємі тетрагідрофурану. Реакційної суміші давали нагрітися до кімнатної температури й перемішували протягом 12год. Потім розчин концентрували у вакуумі й залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (циклогексан:етилацетат 93:7) і одержували трет-бутиловий ефір 4-[[[2-йодтіофен-3-іл]-(2,2,2-трифторацетил)-аміно]-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти у вигляді безбарвного масла (2,27г). ^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 1,5 (s, 9H), 2,15 (m, 2H), 3,43 (m, 1H), 3,52 (m, 1H), 3,75 (d, J=19Гц, 1H), 3,77 (m, 2H), 4,76 (d, J=17Гц, 1H), 5,41 (s, 1H), 6,68 (br d, J=5,5Гц, 1H), 7,42 (d, J=5,5Гц, 1H); МС (ES+) 417 ($\text{M}+\text{H}^+-\text{CO}_2$ -ізобутен), 458 ($\text{M}+\text{H}^+$ -ізобутен).

Стадія В: У висушеній колбі, продутий аргон, трет-бутиловий ефір-[[[2-йодтіофен-3-іл]-(2,2,2-трифторацетил)-аміно]-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти, отриманий на стадії А (1,57г), розчиняли в диметилацетаміді (25мл); послідовно додавали триетиламін (1,05мл), тетрабутиламонійбромід, (1,08г) і ацетат паладію(II) (103мг) і розчин нагрівали при 80°C протягом 4год. Повторно додавали ацетат паладію(II) (20мг) і суміш перемішували при 80°C протягом ще 3год. Після охолодження до кімнатної температури реакційну суміш розбавляли етилацетатом, промивали розсол, сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Хроматографія залишку на силікагелі (циклогексан:етилацетат 8:2) давала трет-бутиловий ефір 4-трифторацетил-спіро[5,6-дигідро-4Н-тієно[3,2-б]пірол-6,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти (0,9г). ^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 2 поворотні ізомери, 1,54 (s, 9H), 2,05 (m, 2H), 3,65-3,80 (m, 2H), 4,20-4,30 (m, 2H), 4,70 й 4,80 (m, 1H), 6,82 й 6,96 (m, 1H), 7,23 (d, J=5,5Гц, 1H), 7,42 (d, J=5,5Гц, 1H); МС (ES+) 288 ($\text{M}+\text{H}^+$ -ізобутен).

Стадія С: Трет-бутиловий ефір 4-трифторацетил-спіро[5,6-дигідро-4Н-тієно[3,2-б]пірол-6,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти, отриманий на стадії В (0,9г) розчиняли в метанолі (30мл) і воді (5мл), поміщали в атмосферу аргону й додавали карбонат калію (28г). Реакційну суміш перемішували протягом 10хв при кімнатній температурі, суміш фільтрували й фільтрат концентрували у вакуумі. Залишок розбавляли етилацетатом, промивали розсол, сушили (над сульфатом натрію) і концентрували у вакуумі. Залишок відразу ж розчиняли в дихлорметані (40мл) і ацилювали за допомогою 2-хлорізонікотиніолхлориду (800мг) у присутності триетиламіну (1мл) при 0°C протягом 1год. За допомогою стандартної обробки водою й хроматографії на силікагелі (циклогексан:етилацетат 8:2) одержували трет-бутиловий ефір 4-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-спіро[5,6-дигідро-4Н-тієно[3,2-б]пірол-6,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти (0,83г). Температура плав-

лення $63-65^{\circ}\text{C}$; МС (ES+) 332/334 ($\text{M}+\text{H}-\text{CO}_2$ -ізобутен), 376/378 ($\text{M}+\text{H}^+$ -ізобутен), 432/434 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Стадія D: Трет-бутиловий ефір 4-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-спіро[5,6-дигідро-4Н-тієно[3,2-б]пірол-6,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти, отриманий на стадії С (216мг), розчиняли в дихлорметані (15мл) і послідовно обробляли триетилсиланом (0,4мл) і трифтороцтовою кислотою (0,75мл); розчин перемішували в атмосфері аргону протягом 6год, розбавляли дихлорметаном, нейтралізували водним розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом натрію) і концентрували у вакуумі. Залишок розчиняли в ацетонітрилі (15мл) і обробляли діізопропіламіном (0,14мл) і 4-хлорцинамілхлоридом (96мг) протягом 24год при кімнатній температурі. За допомогою стандартної обробки водою одержували залишок, який очищали за допомогою флеш-хроматографії (силікагель, циклогексан:етилацетат 8:2+0,5% триетиламін) і одержували шуканий продукт (170мг) у вигляді безбарвної твердої речовини. Температура плавлення $81-82^{\circ}\text{C}$; ^1H ЯМР (600МГц, CDCl_3) 2 поворотні ізомери: 1,81-1,94 (m, 4H), 2,60-2,71 (m, 4H), 3,21 й 3,23 (d, J= 7Гц, 2H), 4,03 й 4,35 (s, 2H), 5,63 й 7,55 (d, J=5,9Гц, 1H), 6,26 й 6,29 (dt, J=12,9Гц, 7Гц, 1H), 6,51 й 6,53 (d, J=12,9Гц, 1H), 6,96 й 7,23 (d, J=5,9Гц, 1H), 7,26-7,49 (m, 6H), 8,53 й 8,54 (d, J=5,9Гц, 1H); ^{13}C ЯМР (125МГц, $\text{CDCl}_2\text{CDCl}_2$, 80°C) вибрані дані 37,3, 51,0,61,1, 67,1 й 77,2, 114,4 й 117,5, 120,3, 122,3, 127,1, 127,5, 127,9, 128,8, 132,0, 150,6; МС (ES+) 484/486/487/489 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Сполуки №№ DCIII-3, DCIII-6, DCIII-7, DCIII-52, DCIII-53 й DCV-53 одержували за методиками, аналогічними до описаних у прикладі 4.

Приклад5

Цей приклад ілюструє одержання сполуки CIII-210, 4-хлор-5-аза-1-(2-хлорпіридин-4-іл)карбоніл-1'-[транс-3-(4-хлорфеюл)аліл]сгаро[індолін-3,4'-піперидину]

Стадія А: 2-Хлор-4-амінопіридин бромировали за методикою, описаною в публікації Synthesis 2001,14, 2175-2179: розчин 4-хлор-4-амінопіридину (12,3г) в ацетонітрилі (500мл) обробляли N-бромсукцинімідом (17,8г) і отриманий розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 24год. Потім розчин концентрували у вакуумі й залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (циклогексан:етилацетат 8:2) і одержували 3-бром-2-хлор-4-амінопіридин (12,2г, т. пл. 146°C (гексан/ефір)) і 5-бром-2-хлор-4-амінопіридин (2,9г, т. пл. $117-119^{\circ}\text{C}$).

Стадія В: Біс(триметилсиліл)амід літію (1М розчин у ТГФ, 5,1мл) при -78°C в атмосфері N_2 при перемішуванні по краплях додавали до розчину 3-бром-2-хлор-4-амінопіридину (1,04г) у тетрагідрофурані (15мл). Отриманий розчин потім перемішували при кімнатній температурі протягом 30хв, нагрівали до 0°C потім повторно охолоджували до -78°C . По краплях додавали 4-трет-бутиловий ефір хлорметил-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти [1,16г, отриманий за методикою, наведеною в WO 98/25605], розчинений у мінімальному об'ємі ТГФ, потім розчин кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 14год. Реак-

ційну суміш охолоджували до кімнатної температури, виливали в розведений водний розчин хлориду амонію, екстрагували за допомогою EtOAc. Органічний шар промивали розсоллом, сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (CH_2Cl_2 , потім $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{EtOAc}$ 8:2, циклогексан:етилацетат 8:2) і одержували трет-бутиловий ефір 4-[(3-бром-2-хлорпіридин-4-іламіно)-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти (1,42г), який ідентифікували за його мас-спектром й ^1H ЯМР спектром. МС (ES^+) 346/348/350 (MH^+ -ізопрен), 402/404/406 (MH^+).

Стадія С: Біс(триметилсиліл)амід літію (1М розчин у ТГФ, 3мл) по краплях додавали при перемішуванні до розчину трет-бутилового ефіру 4-[(3-бром-2-хлорпіридин-4-іламіно)-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти (0,53г) у тетрагідрофурані (20мл) при -78°C в атмосфері N_2 . Жовтий розчин нагрівали до 0°C і потім додавали 2-хлорізонікотиніолхлорид (50% розчин у толуолі, 0,95г). Розчин перемішували при 0°C протягом 10хв, реакцію зупиняли шляхом додатка водного розчину хлориду амонію, екстрагували за допомогою EtOAc, сушили (Na_2SO_4) і концентрували у вакуумі. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (CH_2Cl_2 , потім $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{EtOAc}$ 8:2, циклогексашетилацетат 8:2) і одержували трет-бутиловий ефір 4-[(3-бром-2-хлорпіридин-4-іл)-(2-хлор-піридин-4-карбоніл)-аміно]-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти (0,63г), який ідентифікували за його мас-спектром й ^1H ЯМР спектром. МС (ES^+) 443/445 (MH^+ -BOC), 484/486 (MH^+ -ізопрен).

Стадія D: У висушеній колбі, продутий аргонном, трет-бутиловий ефір 4-[(3-бром-2-хлорпіридин-4-іл)-(2-хлор-піридин-4-карбоніл)-аміно]-метил]-3,6-дигідро-2Н-піридин-1-карбонової кислоти, отриманий на стадії С (0,63г), розчиняли в диметилацетаміді (10мл); послідовно додавали триетиламін (0,41мл), тетрабутиламонійбромід (0,40г) і ацетат паладію(II) (40мг) і розчин нагрівали при 90°C протягом 18год. Після охолодження до кімнатної температури, реакційну суміш розбавляли діетиловим ефіром, промивали розсоллом, сушили над сульфатом натрію й концентрували у вакуумі. Хроматографія залишку на силікагелі (циклогексан:етилацетат 8:2) давала трет-бутиловий ефір 1-(2-хлор-піридин-4-карбоніл)-спіро[[4-хлор-2,3-дигідро-1Н-піроло[3,2-С]піридин]-3,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти (0,21г), який ідентифікували за його мас-спектром й ^1H ЯМР спектром. МС (ES^+) 461/463 (MH^+).

Стадія E: Трет-бутиловий ефір 1-(2-хлор-піридин-4-карбоніл)-спіро[[4-хлор-2,3-дигідро-1Н-піроло[3,2-С]піридин]-3,4'-(1',2',3',4'-тетрагідропіридин)]-1'-карбонової кислоти, отриманий на стадії D (0,19г) розчиняли в дихлорметані (13мл) і послідовно обробляли триетилсиланом (0,33мл) і трифтороцтовою кислотою (0,63мл); розчин перемішували в атмосфері аргону протягом 8год, розбавляли дихлорметаном, нейтралізовували водним розчином бікарбонату натрію, сушили (над сульфатом натрію) і концентрували у вакуумі. Залишок розчиняли в ацетонітрилі (13мл) і обробляли діізопропіламіном (0,12мл) і 4-

хлорцинамілхлоридом (84мг) протягом 48год при кімнатній температурі. За допомогою стандартної обробки водою одержували залишок, який очищали за допомогою флеш-хроматографії (силікагель, циклогексан:етилацетат 8:2+0,5% триетиламін) і одержували шуканий продукт (43мг) у вигляді безбарвної твердої речовини. Температура плавлення $95-96^\circ\text{C}$; МС (ES^+) 513/515 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Сполуки №№ CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-49, CDV-52, DIII-3, DIII-210, DV-3, DV-213 й DV-214 одержували за методиками, аналогічними до описаних у прикладі 5.

Приклад 6

Цей приклад ілюструє пестицидні/інсектицидні характеристики сполуки формули (I). Описані нижче дослідження проводили для наступних шкідників:

Spodoptera littoralis (гусениця совки єгипетської бавовняної)

Диски з листя бавовни поміщали на агар в 24-лункові планшети для мікротитрування й обприскували досліджуваними розчинами при дозі внесення, яка дорівнює 200 част./млн. Після сушіння диски з листя заражали личинками 5 L₁. Зразки досліджували на загинелість, репелентний ефект, поведінку при годуванні й регулювання росту через 3 дні після обробки (ДПО). Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Spodoptera littoralis*: I-26, I-30, I-237, II-26, II-29, II-30, II-210, II-213, II-214, III-3, III-6, III-7, III-26, III-29, III-30, III-210, III-210 N-оксид, III-233, III-236, III-237, III-302, III-325, III-328, III-329, V-26, V-29, V-30, V-209, V-210, V-213, V-214, V-233, V-236, V-237, V-509, VIII-26, VIII-29, VIII-30, VIII-210, VIII-213, XX-26, XX-29, XX-30, XX-210, XX-214, XX-233, XX-236, XX-237, CIII-210, CIII-214, CCCIII-3, CCCIII-26, CCCV-3, CCCV-26, CCCVI-3, CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-49, CDV-52 й DV-3.

Heliothis virescens (гусениця листовійки-брунькоїда тютюнової):

Яйця (0-24-вартові) поміщали на штучний корм в 24-лункові планшети для мікротитрування й за допомогою піпетки обробляли досліджуваними розчинами при дозі внесення, яка дорівнює 200 част./млн. Після інкубаційного періоду тривалістю 4 дні зразки досліджували на загинелість яєць, загинелість личинок і регулювання росту. Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Heliothis virescens*: I-26, I-29, I-30, I-210, I-213, I-214, I-233, I-237, II-26, II-29, II-30, II-210, II-213, II-214, III-3, III-6, III-7, III-26, III-29, III-30, III-210, III-210 N-оксид, III-213, III-214, III-233, III-236, III-237, III-302, III-325, III-328, III-329, V-26, V-29, V-30, V-209, V-210, V-213, V-214, V-233, V-236, V-237, V-509, VIII-26, VIII-29, VIII-30, VIII-210, VIII-213, VIII-214, XX-26, XX-29, XX-30, XX-210, XX-213, XX-214, XX-233, XX-236, XX-237, CIII-49, CIII-52, CIII-53, CIII-210, CIII-214, CIII-555, CCIII-3, CCIII-6, CCIII-7, CCCI-3, CCCII-3, CCCII-26, CCCII-29, CCCII-30, CCCV-3, CCCV-26, CCCV-29, CCCV-30, CCCVI-3, CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-49, CDV-52, DIII-3, DIII-210, DV-3, DCIII-3, DCIII-7, DCIII-52 й DCV-53.

Plutella xylostella (моль капустяна):

24-лункові планшети для мікротитрування (ПМТ) зі штучним кормом за допомогою піпетки обробляли досліджуваними розчинами при дозі

внесення, яка дорівнює 18,2 част./млн. Після сушіння ПМТ заражали личинками (L2) (10-15 на лунку). Після інкубаційного періоду тривалістю 5 днів зразки досліджували на загибель личинок, захист від поїдання й регулювання росту. Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Plutella xylostella*: II-26, II-29, II-30, II-210, II-214, III-3, III-6, III-7, III-26, III-29, III-30, III-210, III-210 N-оксид, III-213, III-214, III-233, III-236, III-237, III-302, III-325, III-328, III-329, V-26, V-29, V-30, V-209, V-210, V-213, V-214, V-233, V-236, V-237, V-509, VIII-26, VIII-29, VIII-30, VIII-210, VIII-213, VIII-214, XX-26, XX-29, XX-30, XX-210, XX-213, XX-214, XX-233, XX-236, XX-237, CIII-49, CIII-52, CIII-53, CIII-210, CIII-214, CIII-555, CCIII-3, CCCIII-3, CCCIII-26, CCCIII-29, CCCV-3, CCCV-26, CCCV-29, CCCV-30, CCCVI-3, CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-52, DV-3, DV-213, DV-214, DCIII-53 й DCV-53.

Myzus persicae (попелиця персикова):

Диски з листя соняшника поміщали на агар в 24-лункові планшети для мікротитрування й обприскували досліджуваними розчинами при дозі внесення, яка дорівнює 200 част./млн. Після сушіння диски з листя заражали популяцією попелиць змішаного віку. Після інкубаційного періоду тривалістю 6 днів зразки досліджували на загибель. Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Myzus persicae*: III-3, III-7, V-213, VIII-29, CCCIII-3, CCCV-3 й DCIII-3.

Aedes aegypti (комар жовтогарячковий):

10-15 личинок комарів (L2) разом з живильною сумішшю поміщали в 96-лункові планшети для мікротитрування. У лунки за допомогою піпетки вносили досліджувані розчини при дозі внесення,

яка дорівнює 2 част./млн. Через 2 дні комах обстежували на загибель і пригнічення росту. Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Aedes aegypti*: I-26, I-210, I-213, I-214, I-233, I-236, I-237, II-26, II-29, II-30, II-210, II-213, II-214, III-3, III-6, III-7, III-26, III-29, III-30, III-210, III-210 N-оксид, III-213, III-214, III-233, III-236, III-237, III-302, III-325, III-328, III-329, V-26, V-29, V-30, V-210, V-213, V-214, V-236, V-237, V-509, VIII-26, VIII-29, VIII-30, VIII-210, VIII-213, VIII-214, XX-26, XX-29, XX-30, XX-210, XX-213, XX-214, XX-233, XX-236, XX-237, CIII-52, CIII-53, CIII-210, CIII-214, CCIII-3, CCIII-6, CCIII-7, CCCI-3, CCCIII-3, CCCIII-26, CCCV-3, CCCIII-26, CCCVI-3, CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-49, CDV-52, DCIII-3, DCIII-6, DCIII-52, DCIII-53 й DCV-53.

Diabrotica balteata (блошка довговуса):

24-лункові планшети для мікротитрування (ПМТ) зі штучним кормом за допомогою піпетки обробляли досліджуваними розчинами при дозі внесення, яка дорівнює 200 част./млн (концентрація в лунках становила 18 част./млн). Після сушіння ПМТ заражали личинками (L2) (6-10 на лунку). Після інкубаційного періоду тривалістю 5 днів зразки досліджували на загибель личинок і регулювання росту. Вказані нижче сполуки забезпечували знищення не менше 80% *Diabrotica balteata*: II-29, II-30, III-29, III-30, III-213, III-236, III-237, V-26, V-29, V-30, V-210, V-213, V-214, V-236, V-237, VIII-29, VIII-30, XX-30, XX-237, CIII-52, CIII-210, CIII-214, CCCIII-29, CCCIII-30, CCCV-3, CCCV-26, CCCV-29, CCCV-30, CDIII-49, CDIII-52, CDIII-53, CDV-49, CDV-52, DV-3, DV-210, DV-213, DCIII-6, DCIII-7 й DCV-53.